



Europäisches Patentamt
European Patent Office
Office européen des brevets



Veröffentlichungsnummer: **0 418 667 A2**

EUROPÄISCHE PATENTANMELDUNG

Anmeldenummer: 90117233.8

Int. Cl.⁵: **C07D 261/18, C07D 275/03, A01N 43/80**

Anmeldetag: 07.09.90

Priorität: 22.09.89 DE 3931627
11.10.89 DE 3933898

Veröffentlichungstag der Anmeldung:
27.03.91 Patentblatt 91/13

Benannte Vertragsstaaten:
BE CH DE ES FR GB IT LI NL SE

Anmelder: BASF Aktiengesellschaft
Carl-Bosch-Strasse 38
W-6700 Ludwigshafen(DE)

Erfinder: Maywald, Volker, Dr.
Berner Weg 24
W-6700 Ludwigshafen(DE)
Erfinder: Freund, Wolfgang, Dr.
Johann-Gottlieb-Fichte-Strasse 71

W-6730 Neustadt(DE)

Erfinder: Hamprecht, Gerhard, Dr.

Rote-Turm-Strasse 28

W-6940 Weinheim(DE)

Erfinder: Kuekenhoechner, Thomas, Dr.

Seidelstrasse 2

W-6710 Frankenthal(DE)

Erfinder: Plath, Peter, Dr.

Hans-Balcke-Strasse 13

W-6710 Frankenthal(DE)

Erfinder: Wuerzer, Bruno, Dr.

Ruedigerstrasse 13

W-6701 Otterstadt(DE)

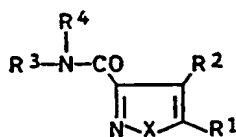
Erfinder: Westphalen, Karl-Otto, Dr.

Mausbergweg 58

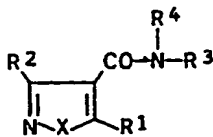
W-6720 Speyer(DE)

Carbonsäureamide.

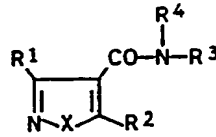
Carbonsäureamide Ia, Ib, Ic und Id



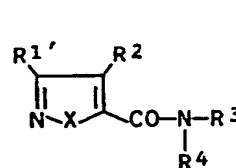
Ia



Ib



Ic



Id

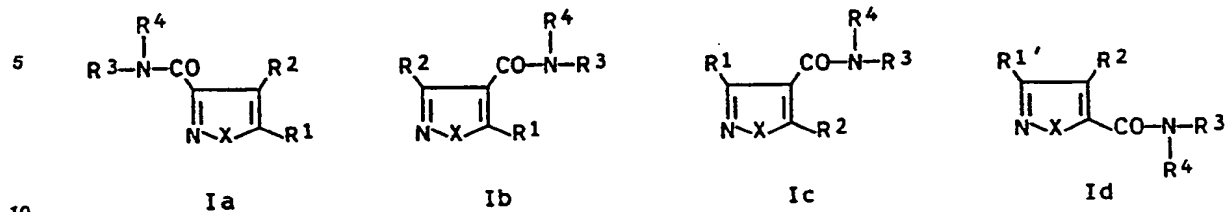
(X = O, S; R¹ = H, Halogen, geg. subst. Alkyl, geg. subst. Benzyl, Alkoxy, Alkylthio, Halogenalkoxy, Halogenalkylthio, geg. subst. Phenyl, geg. subst. Phenoxy oder Phenylthio, ein geg. subst. 5-/6-gliedriger Heterocyclus mit bis zu 2 Heteroatomen, Cycloalkyl-alkyl, geg. subst. Alkenyl, das epoxidiert sein kann, geg. subst. Alkynyl, geg. subst. Cycloalkyl oder Cycloalkenyl; R^{1'} = Cycloalkyl-alkyl, geg. subst. Alkenyl, das epoxidiert sein kann, geg. subst. Cycloalkenyl; R² = CHO, 4,5-Dihydrooxazol-2-yl, COYR⁵, CONR⁵R⁷; Y = O, S; R⁵ = H, geg. subst. Alkyl, Cycloalkyl, geg. subst. Alkenyl, geg. subst. Cycloalkenyl, geg. subst. Alkynyl, geg. subst. Phenyl, ein 5-/6-gliedriger Heterocyclus mit bis zu 3 Heteroatomen, Benzotriazol, N-Phthalimido, Tetrahydrophthalimido, Succinimido, Maleinimido, 2,2-Di-methyl-1,3-dioxolan-4-ylmethyl, 1,3-Dioxolan-2-on-4-ylmethyl, im Falle Y = O: ein Äquivalent eines Kations aus der Gruppe der Alkali- oder Erdalkalimetalle, Mn, Cu, Fe, Ammonium und subst. Ammonium, ein Rest-N = CR⁸R⁹ oder -W-Z; R⁸, R⁹ = H, geg. subst. Alkyl, geg. subst. Halogenalkyl, Cycloalkyl, Alkoxy, Furanyl, geg. subst. Phenyl; R⁸ + R⁹ = 4-7-gliedrige Methylenkette; W = Alkylkette, Ethoxyethylen-

kette, Butenyl-, Butinylenkette; Z = ein in ω -Stellung an W gebundener Molekülteil, der den gleichen Molekülteil darstellt, der in α -Stellung von W mit W verknüpft ist; R^6 = H, Alkyl, Cycloalkyl; R^7 = H; Alkyl; $-C(O\text{-alkyl})=N\text{-H}$ oder $-C(O\text{-alkyl})=N\text{-alkyl}$; $R^6 + R^7$ = 4-5-gliedrige Methylenkette; R^3 = H, geg. subst. Alkyl, geg. subst. Cycloalkyl; R^4 = H, OH, Alkoxy, geg. subst. Alkyl, geg. subst. Cycloalkyl, geg. subst. Alkenyl, geg. subst. Alkynyl, Di-(C₁-C₄)-alkylamino, ein geg. subst. 5-/6-gliedriger Heterocyclus mit bis zu 2 Heteroatomen, geg. subst. Phenyl, geg. subst. Naphthyl; $R_3 + R_4$ = 4-7-gliedrige Methylenkette, kann durch O, S oder N-CH₃ unterbrochen sein, oder $-(CH_2)_3\text{-CO-}$ sowie deren umweltverträglichen Salze.

Die Verbindungen Ia bis Id eignen sich als Herbizide.

CARBONSÄUREAMIDE

Die vorliegende Erfindung betrifft Carbonsäureamide der Formeln Ia, Ib, Ic und Id



in denen die Variablen folgende Bedeutung haben:

X Sauerstoff oder Schwefel;

R¹ - Wasserstoff, Halogen, C₁-C₆-Alkyl, welches ein bis fünf Halogenatome und/oder einen Cyanorest und/oder bis zu zwei der folgenden Reste tragen kann: C₁-C₄-Alkoxy, partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio oder partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₄-Alkylthio;

- eine C₁-C₄-Alkoxy- oder C₁-C₄-Alkylthiogruppe, eine partiell oder vollständig halogenierte C₁-C₄-Alkoxygruppe, eine partiell oder vollständig halogenierte C₁-C₄-Alkylthiogruppe;

- die Benzylgruppe, die ein- bis dreimal durch C₁-C₄-Alkyl, partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₄-Alkylthio, Halogen, Cyano oder Nitro substituiert sein kann;

- die Phenylgruppe, welche noch einen bis drei der folgenden Reste tragen kann: Cyano, Nitro, Halogen, C₁-C₆-Alkyl, partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Alkylthio und/oder partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₆-Alkylthio;

- die Phenoxy- oder die Phenylthiogruppe, wobei beide Gruppen ein- bis dreimal durch C₁-C₄-Alkyl, partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₄-Alkylthio, Halogen, Cyano oder Nitro substituiert sein können;

- ein 5- bis 6-gliedriger gesättigter oder aromatischer heterocyclischer Rest, enthaltend ein oder zwei Heteroatome, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff, der ein oder zwei der folgenden Substituenten tragen kann: Halogen C₁-C₃-Alkyl, C₁-C₃-Alkoxy und C₁-C₃-Alkoxycarbonyl;

- eine durch C₃-C₈-Cycloalkyl substituierte C₁-C₆-Alkylgruppe;

- eine C₂-C₆-Alkenylgruppe, deren Doppelbindung epoxidiert sein kann, oder eine C₂-C₆-Alkynylgruppe, wobei beide Gruppen ein- bis dreimal durch Halogen, C₁-C₃-Alkoxy und/oder einmal durch Cyclopropyl oder Phenyl substituiert sein können, wobei der Phenylrest zusätzlich bis zu drei der folgenden Substituenten tragen kann: Halogen, Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, das unsubstituiert oder partiell oder vollständig halogeniert sein kann, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Alkylthio, die beide unsubstituiert oder partiell oder vollständig halogeniert sein können;

- eine C₃-C₈-Cycloalkyl- oder eine C₃-C₆-Cycloalkenylgruppe, wobei beide Gruppen ein- bis dreimal durch C₁-C₄-Alkyl oder Halogen substituiert sein können;

R^{1'} - eine durch C₃-C₈-Cycloalkyl substituierte C₁-C₆-Alkylgruppe;

- eine C₂-C₆-Alkenylgruppe, deren Doppelbindung epoxidiert sein kann, oder eine C₂-C₆-Alkynylgruppe, wobei beide Gruppen ein- bis dreimal durch Halogen, C₁-C₃-Alkoxy und/oder einmal durch Cyclopropyl oder Phenyl substituiert sein können, wobei der Phenylrest zusätzlich bis zu drei der folgenden Substituenten tragen kann: Halogen, Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, das unsubstituiert oder partiell oder vollständig halogeniert sein kann, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Alkylthio, die beide unsubstituiert oder partiell oder vollständig halogeniert sein können;

- eine C₃-C₆-Cycloalkenylgruppe, die ein- bis dreimal durch Halogen oder C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann;

R² - eine Formylgruppe, eine 4,5-Dihydrooxazol-2-ylgruppe,

- ein Rest COYR⁵ oder CONR⁵R⁷, wobei die Variablen die folgende Bedeutung haben:

Y Sauerstoff oder Schwefel;

R⁵ - Wasserstoff;

- eine C₁-C₆-Alkylgruppe, welche ein bis fünf Halogenatome und/oder bis zu drei Hydroxy- und/oder C₁-C₄-

Alkoxygruppen und/oder einen der folgenden Reste tragen kann:

- Cyano,
- C₁-C₄-Alkoxy-C₂-C₄-alkoxy,
- C₁-C₃-Alkylthio,
- 5 - C₁-C₃-Alkylamino, Di-(C₁-C₃)-alkylamino, C₃-C₆-Cycloalkylamino oder Di-(C₃-C₆)-cycloalkylamino,
- Trimethylsilyl,
- C₁-C₃-Alkylsulfinyl oder C₁-C₃-Alkylsulfonyl,
- Carboxyl, C₁-C₃-Alkoxy-carbonyl, C₁-C₃-Alkoxy-carbonyl-C₁-C₃-alkoxy oder C₁-C₃-Alkoxy-carbonyl-C₁-C₃-alkoxy-C₁-C₃-alkoxy-carbonyl,
- 10 - Di-(C₁-C₃)-alkylaminocarbonyl,
- Di-(C₁-C₃)-alkoxyphosphonyl,
- C₁-C₆-Alkaniminoxy oder C₅-C₆-Cycloalkaniminoxy,
- N-Phthalimido, N-Succinimido, Benzoyloxy, Benzoyl, wobei diese cyclischen Reste zusätzlich eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können: Halogen, C₁-C₃-Alkyl oder C₁-C₃-Alkoxy,
- 15 - einen 5- oder 6-gliedrigen gesättigten heterocyclischen Rest oder einen 5- oder 6-gliedrigen heteroaromatischen Rest mit jeweils bis zu 3 Heteroatomen, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff, wobei zwei Sauerstoff- und/oder Schwefelatome nicht direkt benachbart sein können und wobei die Heterocyclen noch einen oder zwei der folgenden Substituenten tragen können: Halogen, C₁-C₃-Alkyl, C₁-C₃-Alkoxy oder C₁-C₃-Alkoxy-carbonyl;
- 20 - Phenyl, das noch bis zu drei der folgenden Substituenten tragen kann: Halogen, Nitro, Cyano, C₁-C₃-Alkyl, partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₃-Alkyl, C₁-C₃-Alkoxy oder partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₃-Alkoxy;
- einen Rest -CR¹⁰ = N-R¹¹, wobei R¹⁰ und R¹¹ die folgende Bedeutung haben:
R¹⁰ Wasserstoff oder C₁-C₆-Alkyl und
- 25 R¹¹ C₁-C₆-Alkoxy, C₃-C₆-Alkenyloxy oder C₃-C₆-Alkinyloxy, die jeweils bis zu 3 Halogenatome und/oder einen Phenylrest mit gewünschtenfalls bis zu drei der folgenden Reste tragen können: Halogen, Nitro, Cyano, C₁-C₃-Alkyl oder C₁-C₃-Alkoxy; Phenoxy, das noch bis zu drei der folgenden Substituenten tragen kann: Halogen, Nitro, Cyano, C₁-C₃-Alkyl oder C₁-C₃-Alkoxy;
- C₁-C₆-Alkylamino, Di-(C₁-C₆)-alkylamino oder Phenylamino, wobei der Aromat zusätzlich bis zu drei der
- 30 folgenden Reste tragen kann: Halogen, Nitro, Cyano, C₁-C₃-Alkyl oder C₁-C₃-Alkoxy;
- C₃-C₈-Cycloalkyl;
- C₃-C₆-Alkenyl, C₅-C₆-Cycloalkenyl, C₃-C₆-Alkynyl, wobei diese Reste eine der folgenden Gruppen tragen können: Hydroxy, Halogen, C₁-C₄-Alkoxy oder Phenyl, wobei der Aromat seinerseits eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Halogen, Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, partiell oder vollständig halogeniertes
- 35 C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy;
- Phenyl, das eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Halogen, Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl;
- einen fünf- oder sechsgliedrigen heterocyclischen Rest mit bis zu drei Heteroatomen, ausgewählt aus der
- 40 Gruppe Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff, wobei zwei Sauerstoff- und/oder Schwefelatome nicht direkt benachbart sein können und wobei die Heterocyclen noch einen oder zwei der folgenden Substituenten tragen können: Halogen, C₁-C₃-Alkyl, C₁-C₃-Alkoxy oder C₁-C₃-Alkoxy-carbonyl;
- einen Benzotriazolrest;
- N-Phthalimido, Tetrahydrophthalimido, Succinimido, Maleinimido;
- 45 - die 2,2-Dimethyl-1,3-dioxolan-4-ylmethyl- oder 1,3-Dioxolan-2-on-4-ylmethylgruppe;
- im Falle Y = O: ein Äquivalent eines Kations aus der Gruppe der Alkali- und Erdalkalimetalle, Mangan, Kupfer, Eisen, Ammonium und mit bis zu 4 C₁-C₃-Alkylgruppen substituiertes Ammonium;
- oder
- ein Rest -N = CR⁸R⁹, wobei
- 50 R⁸, R⁹ Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, das unsubstituiert oder partiell oder vollständig halogeniert sein und einen C₁-C₃-Alkoxy- oder Phenylrest tragen kann, wobei der aromatische Rest seinerseits noch ein bis dreimal durch Halogen, Nitro, Cyano, C₁-C₃-Alkyl, partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₃-Alkyl, C₁-C₃-Alkoxy oder partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₃-Alkoxy substituiert sein kann; C₃-C₆-Cycloalkyl; C₁-C₄-Alkoxy; Furanyl oder Phenyl, das zusätzlich bis zu drei der folgenden Substituenten tragen kann: Halogen,
- 55 Nitro, Cyano, C₁-C₃-Alkyl, partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₃-Alkyl, C₁-C₃-Alkoxy oder partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₃-Alkoxy;
- oder R⁸ und R⁹ gemeinsam eine Methylenkette mit 4 bis 7 Gliedern bedeuten;
- einen Rest -W-Z, wobei W eine C₂-C₄-Alkylenkette, eine Ethoxyethylenkette, eine But-2-enylen- oder eine

But-2-inylenkette bedeutet und Z einen in ω -Stellung an W gebundenen Molekülteil, der den gleichen Molekülteil darstellt, der in α -Stellung von W mit W verknüpft ist, bedeutet;

R⁶ - Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl oder C₃-C₈-Cycloalkyl und

R⁷ - Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, -C(OR¹²)=N-H oder -C(OR¹²)=N-(C₁-C₄)-alkyl, wobei R¹² C₁-C₄-Alkyl

5 bedeutet oder

R⁶, R⁷ gemeinsam eine Methylenkette mit 4 oder 5 Gliedern;

R³ - Wasserstoff;

- C₁-C₆-Alkyl, das einen bis drei der folgenden Substituenten tragen kann: Hydroxy, Halogen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio oder Di-(C₁-C₄)-alkylamino;

10 - C₃-C₈-Cycloalkyl, das ein- bis dreimal durch Halogen, C₁-C₄-Alkyl und partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann;

R⁴ - Wasserstoff, Hydroxyl, eine C₁-C₄-Alkoxygruppe;

15 - eine C₁-C₆-Alkylgruppe, die einen bis drei der folgenden Reste tragen kann: Halogen, Cyano, C₁-C₄-Alkoxy, partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₄-Alkylthio, Di-C₁-C₄-alkylamino, C₃-C₈-Cycloalkyl oder Phenyl, wobei der Phenylring seinerseits einen bis drei der folgenden Reste tragen kann: Halogen, Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio oder partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₄-Alkylthio;

20 - eine C₃-C₈-Cycloalkylgruppe, die einen bis drei der folgenden Reste tragen kann: Halogen, Nitro, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₄-Alkoxy;

- eine C₃-C₆-Alkenyl- oder C₃-C₆-Alkynylgruppe, die jeweils ein- bis dreimal durch Halogen und/oder einmal durch Phenyl substituiert sein können, wobei der Phenylrest seinerseits eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, Halogen, Cyano oder Nitro;

25 - eine Di-(C₁-C₄)-alkylaminogruppe;

- ein 5- bis 6-gliedriger heterocyclischer gesättigter oder aromatischer Rest mit einem oder zwei Heteroatomen, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff, der ein- bis dreimal durch C₁-C₄-Alkyl oder Halogen substituiert sein kann;

30 - eine Phenylgruppe, die eine bis vier der folgenden Gruppen tragen kann: C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, Halogen, Nitro, Cyano, Formyl, C₁-C₄-Alkanoyl, C₁-C₄-Halogenalkanoyl oder C₁-C₄-Alkoxycarbonyl;

- eine Naphthylgruppe, die ein- bis dreimal durch C₁-C₄-Alkyl oder Halogen substituiert sein kann;

oder

35 R³, R⁴ gemeinsam eine Methylenkette mit 4 bis 7 Gliedern, welche durch Sauerstoff, Schwefel oder N-Methyl unterbrochen sein kann, oder den Rest -(CH₂)₃-CO-, wobei im Falle der Verbindungen Ia bis Ic R³ und R⁴ nicht gleichzeitig Wasserstoff bedeuten, wenn

- R¹ Wasserstoff, Methyl oder Phenyl und R² CONH₂, COOH oder COOCH₃ bedeuten oder wenn

- X Sauerstoff, R¹ CH(OCH₂CH₃)₂ und R² CONH₂ bedeuten,

40 sowie die umweltverträglichen Salze der Verbindungen Ia bis Id.

Außerdem betrifft die Erfindung herbizide Mittel, welche die Verbindungen Ia bis Id als wirksame Substanzen enthalten sowie herbizide Mittel, welche mindestens eine Verbindung Ia', Ib' oder Ic' enthalten, in denen die Substituenten die vorstehend gegebene Bedeutung haben und R³ und R⁴ gleichzeitig Wasserstoff bedeuten können, wenn

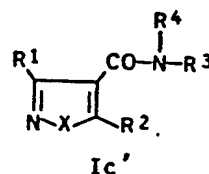
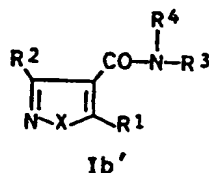
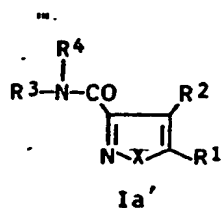
45 - R¹ Wasserstoff, Methyl oder Phenyl und R² CONH₂, CO₂H oder CO₂CH₃ bedeuten oder wenn

- X Sauerstoff, R¹ CH(OCH₂CH₃)₂ und R² CONH₂ bedeuten.

Isloxazol- und Isothiazol-carbonsäuren bzw. deren Derivate sind bekannt. Dies sind folgende Carbonsäureamide vom Typ Ia', Ib' und Ic':

50

55



| Ia' | X | R1 | R2 | R3 | R4 | Lit. |
|-----|---|--|-------------------|----|----|------|
| 1. | O | CH(OCH ₂ CH ₃) ₂ | CONH ₂ | H | H | 1 |
| 2. | S | H | CONH ₂ | H | H | 2 |
| 3. | S | H | COOH | H | H | 2 |

| Ib' | X | R1 | R2 | R3 | R4 | Lit. |
|-----|---|----|------|----|----|------|
| 1. | S | H | COOH | H | H | 2 |

| Ic' | X | R1 | R2 | R3 | R4 | Lit. |
|-----|---|-----------------|--------------------|----|----|------|
| 1. | S | H | COOH | H | H | 3 |
| 2. | O | Ph | COOH | H | H | 4 |
| 3. | O | Ph | COOCH ₃ | H | H | 4 |
| 4. | O | CH ₃ | COOH | H | H | 5 |

- 1) K. Butler; L.H. Conover, R.B. Woodward, U.S., US 3 699 117, 17 Oct. 1972, 40 pp; CA 78(1): 4027x, CA 73(23): 120 602b, CA 73(3): 14574j, CA 70(15): 68002c
- 2) J. Chem. Soc., 7277 (1965)
- 3) J. Chem. Soc., 3061 (1959)
- 4) G. Desimoni, P. Gruenager, Gazz.Chim.Ital., 97(1), 25-33 (1967)
- 5) A. Camparini; F. Ponticelli, P. Tedeschi, J.Chem.Soc., Perkin Trans 1, (10), 2391-4 (1982)

Vom Typ der Verbindungen Ia sind dies die 5-Aminocarbonyl-3-methyl-4-isoxazolcarbonsäure, der 5-Aminocarbonyl-3-methyl-4-isoxazolcarbonsäureethylester, das Isothiazol-4,5-dicarboxamid sowie die 5-Carbamoyl-4-isothiazolcarbonsäure (J. Chem. Soc. Perkin Trans. I, 1982, 2391; J. Heterocyclic. Chem. 22, 1561 (1985); J. Chem. Soc. 1959, 3061).

Eine Verwendung dieser Verbindungen als Herbizide ist jedoch unbekannt.

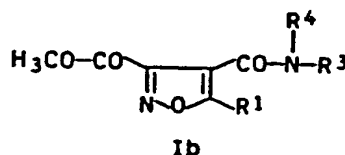
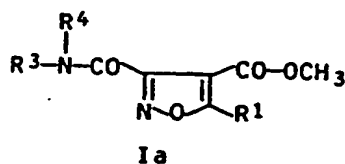
Aufgabe der vorliegenden Erfindung war es, neue herbizid wirksame Verbindungen bereitzustellen.

Demgemäß wurden die eingangs definierten Carbonsäureamide Ia, Ib, Ic und Id gefunden.

Außerdem wurden Verfahren zu ihrer Herstellung und herbizide Mittel, die die Verbindungen Ia, Ib, Ic und/oder Id enthalten, gefunden.

Die erfindungsgemäßen Carbonsäureamide Ia, Ib, Ic und Id sind auf verschiedenen Wegen herstellbar und zwar vorzugsweise nach den folgenden Verfahren:

1. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formeln Ia und Ib, in denen R² CO₂CH₃ und X Sauerstoff bedeuten



Man erhält die Carbonsäureamide Ia und Ib dadurch, daß man das Hydroxamsäurechlorid II in an sich

5 einem Amin Vla amidiert.



25

30

39

39

41

41

4

5

5

5

Reaktionsschritt C:

Man erhält die Verbindungen Ia bzw. Ib aus den Monoestern Va und Vb, in dem man Va und Vb zunächst in an sich bekannter Weise in das Halogenid oder eine andere aktivierte Form der Carbonsäurefunktion überführt und diese Derivate anschließend mit einem Amin VIa amidiert.

Aktivierte Formen der Carbonsäure sind neben Halogeniden wie insbesondere den Chloriden und den Bromiden beispielsweise auch Imidazolide. Im allgemeinen werden die Halogenide bevorzugt.

Man erhält sie durch Umsetzung der Carbonsäuren Va und Vb mit einem Halogenierungsmittel wie Phosgen, Thionylchlorid, Thionylbromid, Phosphoroxychlorid bzw. -bromid, Phosphortri- und -pentachlorid bzw. -bromid sowie elementarem Chlor und Brom.

Das Halogenierungsmittel wird in 1 bis 5 mol.-äq., vorzugsweise 1 bis 2 mol.-äq., eingesetzt.

Die Umsetzung verläuft bei Temperaturen von 20° C bis zum Siedepunkt des Halogenierungsmittels bzw. sofern man in Gegenwart eines inerten organischen Lösungsmittels arbeitet, auch dessen Siedepunkt.

Als Lösungsmittel eignen sich beispielsweise Kohlenwasserstoffe wie Benzol, Toluol, o-, m- und p-Xylol, Halogenkohlenwasserstoffe wie Dichlormethan, Chloroform, 1,2-Dichlorethan, 1,1,2,2-Tetrachlorethan, Chlorbenzol und 1,2-Dichlorbenzol sowie Gemische der genannten Lösungsmittel.

Üblicherweise werden die aktivierten Carbonsäurederivate isoliert, beispielsweise durch Abdestillieren des Halogenierungsmittels und sofern vorhanden des Lösungsmittels und erst anschließend mit den Aminen VIa umgesetzt.

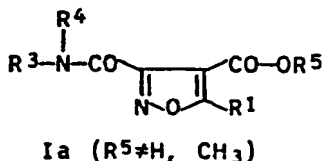
In diesem Fall wird die Amidierung bei Temperaturen von (-20) bis 50° C, vorzugsweise 0 bis 30° C in einem inerten aprotisch polaren organischen Lösungsmittel durchgeführt.

Für diese Umsetzung eignen sich insbesondere Kohlenwasserstoffe wie Benzol, Toluol, o-, m-, p-Xylol, Halogenkohlenwasserstoffe wie Dichlormethan und Ether wie Diethylether und tert.-Butylmethylether als Lösungsmittel.

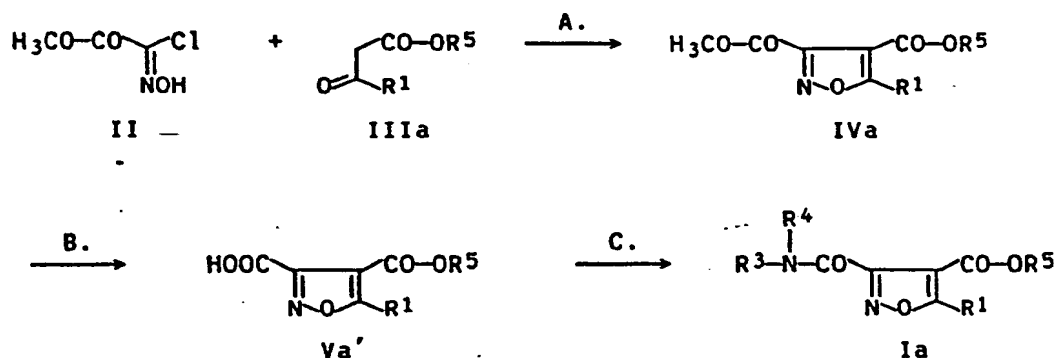
Da bei der Amidierung von Säurehalogeniden Halogenwasserstoff gebildet wird, empfiehlt es sich, das Amin VIa in 2 bis 5 mol.-äq. Überschuß, vorzugsweise 2 bis 3 mol.-äq. zuzusetzen. Sofern das Amin in äquimolaren Mengen (1 bis 1,2 mol.-äq.) eingesetzt wird, sollte zum Binden des Halogenwasserstoffs eine Base, insbesondere ein tertiäres Amin wie Triethylamin oder Pyridin zugegeben werden.

Sofern man von einem Gemisch der Monoester Va und Vb ausgeht, erhält man bei der Umsetzung ein Gemisch aus den isomeren Carbonsäureamididen Ia und Ib. Dieses Gemisch kann auf herkömmliche Weise, beispielsweise durch fraktionierte Kristallisation oder Chromatographie in die Einzelkomponenten aufgetrennt werden.

2. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen Ia, in denen X Sauerstoff, R² CO-OR⁵ und R⁵ nicht Wasserstoff oder Methyl bedeuten:



In Analogie zu dem unter 1. geschilderten Verfahren erhält man diese Verbindungen Ia, indem man das Hydroxamsäurechlorid II in der vorstehend geschilderten Weise mit einem β -Ketoester der Formel IIIa umsetzt, den so erhaltenen Diester IVa anschließend mit einem Verseifungsreagens in den Monoester Va spaltet und diesen aktiviert und zu Ia amidiert.



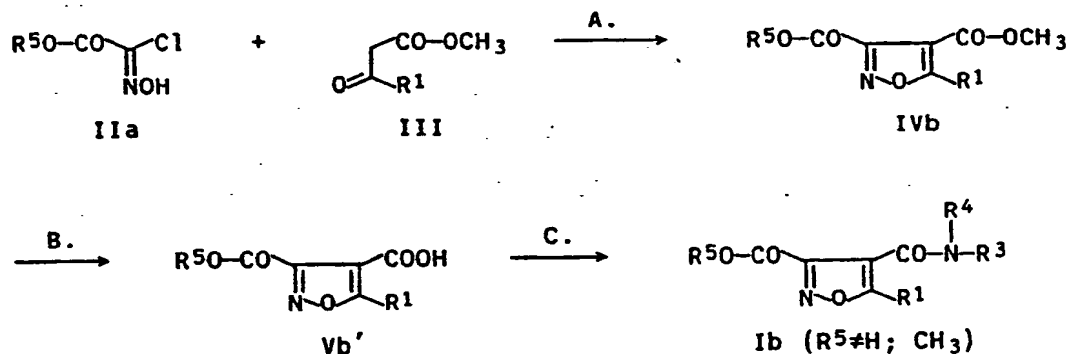
Die Reaktionsschritte A und C dieser Synthesesequenz werden im allgemeinen und im besonderen entsprechend den bei Verfahren 1A und 1C geschilderten Bedingungen durchgeführt.

Reaktionsschritt B:

Die partielle Verseifung des gemischten Diesters IVa zum Monoester Va' wird üblicherweise bei Temperaturen von (-40) bis 20 °C, vorzugsweise (-20) bis 0 °C, in einem inerten organischen Lösungsmittel durchgeführt.

Diese Verfahren sind allgemein bekannt und können gemäß den in der Literatur beschriebenen Bedingungen durchgeführt werden.

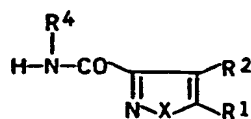
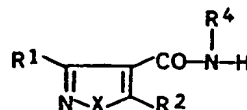
Sofern man bei dieser Art von Synthese ein Hydroxamsäurechlorid IIa mit einem β-Ketoester III umsetzt, ist es auch möglich auf dem gleichen Weg gezielt die Verbindungen Ib herzustellen, in denen X Sauerstoff, R² CO₂R⁵ und R⁵ nicht Wasserstoff oder Methyl bedeuten.



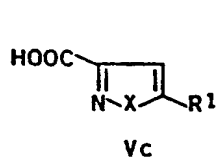
Die letztgenannten Verfahren zur gezielten Herstellung eines Isomeren der beiden Carbonsäureamide Ia und Ib beruhen auf der Möglichkeit bei zwei unterschiedlichen Estergruppen einer Verbindung durch die Verwendung nur eines mol-Äquivalents an Verseifungsreagens unter milden Reaktionsbedingungen selektiv die eine Estergruppe zu spalten.

Als Verseifungsreagentien eignen sich beispielsweise Hydroxide von Alkalimetall-Kationen bei unverzweigten Alkylestern, Mineralsäuren bei α-verzweigten Alkylestern und Wasserstoff bei der Hydrogenolyse von Benzyl und Allylestern.

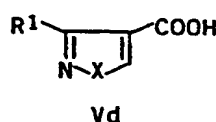
3. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen Ia und Ic, in denen R¹ nicht Wasserstoff und R² Carboxyl oder Formyl und R³ Wasserstoff bedeuten:

Ia ($\text{R}^1 \neq \text{H}$; $\text{R}^2 = \text{CO}_2\text{H}$, CHO)Ic ($\text{R}^1 \neq \text{H}$; $\text{R}^2 = \text{CO}_2\text{H}$, CHO)

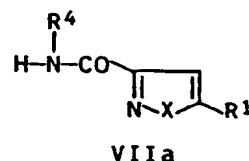
Man erhält diese isomeren Carbonsäureamide Ia und Ic, indem man eine Carbonsäure Vc oder Vd gemäß den unter 1C geschilderten Bedingungen aktiviert und amidiert und die so erhaltenen Amide VIIa bzw. VIIb anschließend in an sich bekannter Weise in Gegenwart eines Carboxylierungsreagens oder eines Formylierungsreagens umsetzt.



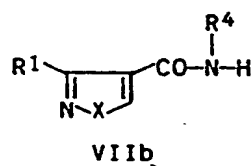
oder



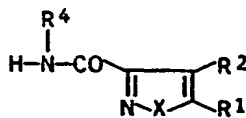
A.



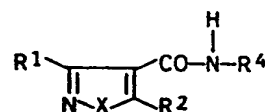
oder



B.

Ia ($\text{R}^1 \neq \text{H}$; $\text{R}^2 = \text{CO}_2\text{H}$, CHO)

oder

Ic ($\text{R}^1 \neq \text{H}$; $\text{R}^2 = \text{CO}_2\text{H}$, CHO)

Der Reaktionsschritt A dieser Synthesesequenz wird im allgemeinen und im besonderen entsprechend den im Verfahren 1 unter Punkt C beschriebenen Bedingungen durchgeführt.

Reaktionsschritt B

Die Formylierung bzw. Carboxylierung der Carbonsäureamide VIIa ($\text{X} = \text{O}, \text{S}$) bzw. VIIb ($\text{X} = \text{S}$) erfolgt im allgemeinen bei Temperaturen von (-100) bis 0°C , vorzugsweise (-80) bis $(-20)^\circ \text{C}$, die Formylierung bzw. Carboxylierung der Carbonsäureamide VIIb ($\text{X} = \text{O}$) vorteilhaft bei Temperaturen $<(-80)^\circ \text{C}$. Bevorzugt arbeitet man in einem aprotisch polaren inerten organischen Lösungsmittel unter Ausschluß von Feuchtigkeit und in Gegenwart einer Base.

Als Formylierungsreagens eignen sich insbesondere Dimethylformamid und N-Formylmorpholin, bevorzugtes Carboxylierungsmittel ist Kohlendioxid.

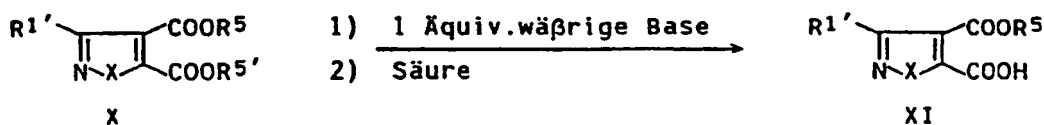
Geeignete Lösungsmittel sind insbesondere Diethylether, tert.-Butylmethylether, Tetrahydrofuran und Dioxan.

Als Basen finden bevorzugt Alkalimetallkohlenwasserstoffe wie Methyllithium, n-Butyllithium, tert.-Butyllithium und Phenyllithium Verwendung.

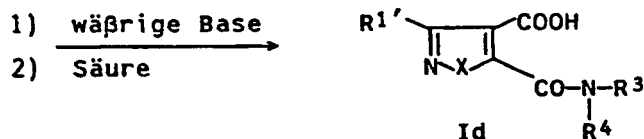
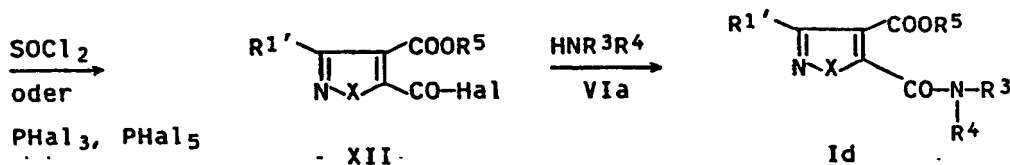
Die Umsetzung wird üblicherweise so durchgeführt, daß zunächst eine Lösung des Carbonsäureamids VIIa bzw. VIIb mit 2 bis 2,5 mol-äq. der gelösten Base versetzt wird, wobei ein im Ring metallisiertes Carbonsäureamid-derivat entsteht, welches bei der anschließenden Zugabe des elektrophilen Formylierungs- bzw. Carboxylierungsreagens zum gewünschten Produkt Ia bzw. Ic abreagiert.

Die für dieses Verfahren benötigten Carbonsäuren Vc und Vd sind literaturbekannt (Beilstein, Hauptwerk sowie 1.-5. Ergänzungswerk, Band 27; R.W. Wiley, The Chemistry of Heterocyclic Compounds, Five- and Six-Membered Compounds with Nitrogen and Oxygen, Interscience Publishers, New York, London (1962)) oder können nach allgemein literaturbekannten Methoden, z.B. durch Oxidation aus den entsprechenden Alkoholen oder Aldehyden oder durch Hydrolyse aus den entsprechenden Nitrilen, hergestellt werden.

4. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel Id, in der $\text{R}^2 \text{COOR}^5$ und R^5 Wasserstoff oder $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-Alkyl}$ bedeuten, durch Hydrolyse eines Isoxazol- oder Isothiazol-4,5-dicarbon säuredialkylesters X ($\text{R}^5 = \text{C}_1\text{-C}_6\text{-Alkyl}$), Überführung des Verfahrensproduktes in ein Säurehalogenid XII und Amidierung des Säurechlorides:



(R⁵ = R^{5'} = C₁-C₆-Alkyl)



Als Isoxazol- oder Isothiazol-4,5-dicarbonsäuredialkylester X eignen sich insbesondere Niedrigalkylester (R⁵ = R^{5'} = C₁-C₄-Alkyl), wobei Dimethylester und Diethylester besonders bevorzugt sind.

Die Reaktion wird so durchgeführt, daß man einen Isoxazol- bzw. Isothiazol-4,5-dicarbonsäuredialkylester X bei Temperaturen zwischen etwa 0 und 80°C, vorzugsweise zwischen 0 und 50°C, in einem organischen Lösungsmittel, z.B. Methanol oder Ethanol, mit einer starken Base, z.B. NaOH, KOH oder Ca(OH)₂, behandelt. Im allgemeinen wird dabei etwa 1 Äquivalent der starken Base in wäßriger Lösung eingesetzt. Nach erfolgter Umsetzung wird abgekühlt und mit einer starken Mineralsäure, z.B. Salzsäure oder Schwefelsäure, angesäuert. Die entstehende Carbonsäure XI kann auf übliche Art und Weise z.B. durch Absaugen oder durch Extraktion mit einem organischen Lösungsmittel isoliert werden.

Zur Überführung der Carbonsäure XI in das Carbonsäurehalogenid XII bringt man die Säure XI in üblicher Art und Weise mit einem anorganischen Säurehalogenid wie Thionylchlorid, Phosphortri- oder Phosphorpentahalogeniden, zur Reaktion, wobei die Chloride bevorzugt sind. Dabei wird zweckmäßigerweise das anorganische Säurehalogenid in 1 bis 5 Moläquivalenten, vorzugsweise 1 bis 2 Moläquivalenten, eingesetzt. Man kann ohne Lösungsmittel oder in Gegenwart eines inerten organischen Lösungsmittels wie z.B. Benzol oder Toluol bei Temperaturen zwischen Raumtemperatur und der Siedetemperatur des anorganischen Säurehalogenids bzw. des inerten organischen Lösungsmittels arbeiten. In manchen Fällen kann der Zusatz eines Katalysators wie Dimethylformamid oder 4-Dimethylaminopyridin von Vorteil sein. Nach Beendigung der Reaktion kann das Säurehalogenid XII auf übliche Art und Weise isoliert werden, z.B. durch Abdestillation des Überschusses an anorganischem Säurehalogenid und des organischen Lösungsmittels und nachfolgende Destillation des Säurechlorids XII bei Normaldruck oder vermindertem Druck.

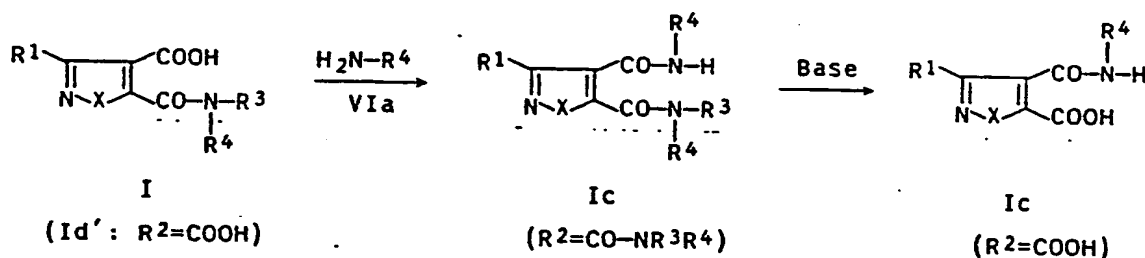
Die Carbonsäureamide der Formel Id, in der R² COOR⁵ und R⁵ C₁-C₆-Alkyl bedeuten, erhält man aus den Carbonsäurehalogeniden XII durch Umsetzung mit einem Amin Vla. Dabei geht man im allgemeinen so vor, daß man das Carbonsäurehalogenid in einem inerten organischen Lösungsmittel wie Dichlormethan, oder einem Ether wie Diethylether oder Methyl-tert.-butylether mit einem Amin Vla, ebenfalls gelöst in einem organischen Lösungsmittel, zur Reaktion bringt. Dabei setzt man das Amin Vla zweckmäßig in der 2- bis 5-fach molaren Menge, vorzugsweise 2- bis 3-fachen molaren Menge ein, um den entstehenden Halogenwasserstoff zu binden. Man kann auch in Gegenwart einer Hilfsbase wie einem tertiären Amin, z.B. Triethylamin, arbeiten. In diesem Fall genügen 1 bis 1,5 Moläquivalente Amin Vla. Die Reaktionstemperatur kann z. B. zwischen 0 und 50°C, vorzugsweise zwischen 0 und 20°C betragen. Die Reaktion ist im allgemeinen nach 1 bis 12 Stunden beendet. Das Gemisch kann wie üblich aufgearbeitet werden, beispielsweise durch Hydrolyse mit Wasser und anschließender Extraktion des Produktes der Formel Id (R² = COOR⁵; R⁵ = C₁-C₆-Alkyl) mit einem organischen Lösungsmittel und Einengen des organischen Lösungsmittels. Zur Reinigung kann das Produkt der Formel Id (R² = COOR⁵; R⁵ = C₁-C₆-Alkyl) beispielsweise umkristallisiert oder chromatographiert werden.

Vorteilhaft kann die Darstellung des Säureamids Id (R² = COOR⁵, R⁵ = C₁-C₆-Alkyl) aus der Carbonsäure XI auch in einer Stufe durchgeführt werden. Dazu wird die Carbonsäure XI mit einem Amin Vla in Gegenwart eines wasserentziehenden Mittels, z.B. Propanphosphonsäureanhydrid (PPA) oder Dicycloh-

exylcarbodiimid (DCC), bei Temperaturen von 0 bis 50°C, bevorzugt 5 bis 25°C in einem inerten Lösungsmittel wie Dichlormethan, Tetrahydrofuran, Toluol oder Ethylacetat zur Reaktion gebracht.

Aus den 4-Alkoxycarbonyl-isoxazol-5-carbonsäureamiden bzw. 4-Alkoxycarbonyl-isothiazol-5-carbonsäureamiden Id ($R^2 = \text{COOR}^5$ mit $R^5 = \text{C}_1\text{-C}_6\text{-Alkyl}$) lassen sich die freien Carbonsäuren Id ($R^2 = \text{COOH}$) z.B. durch Hydrolyse mit wäßrigen Basen und anschließender Neutralisierung mit Mineralsäuren erhalten. Die Reaktion wird so durchgeführt, daß man den Ester Id ($R^2 = \text{COOR}^5$, $R^5 = \text{C}_1\text{-C}_6\text{-Alkyl}$) bei Temperaturen zwischen 0 und 80°C, vorzugsweise zwischen 0 und 50°C, in einem organischen Lösungsmittel, z.B. Methanol oder Ethanol mit einer Base, z.B. NaOH, KOH oder Ca(OH)_2 behandelt. Im allgemeinen werden dabei etwa 1 bis 3 Äquivalente, vorzugsweise 1 bis 1,5 Äquivalente der starken Base in wäßriger Lösung eingesetzt. Nach erfolgter Umsetzung wird unter Kühlung mit einer starken Mineralsäure, z.B. Salzsäure oder Schwefelsäure, angesäuert. Die entstehenden Carbonsäuren Id ($R^2 = \text{COOH}$) können durch Absaugen oder durch Extraktion mit einem organischen Lösungsmittel und Einengen dieses organischen Lösungsmittels isoliert werden. Die weitere Reinigung erfolgt z.B. durch Umkristallisieren oder Chromatographieren.

5. Verfahren zur Synthese von Dicarbonsäurediamiden der Formel Ic, in der $R^2 = \text{CO-NR}^3\text{R}^4$ ($R^3, R^4 \neq \text{H}$) bedeutet, durch Umsetzung der Säuren Id' mit einem primären Amin VIa in Gegenwart eines wasserentziehenden Mittels:

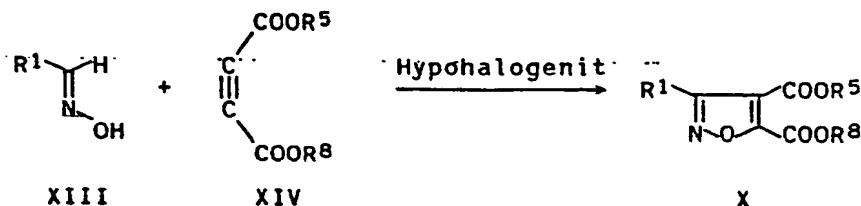


Als wasserentziehendes Mittel eignen sich z.B. Propanphosphorsäureanhydrid oder Dicyclohexylcarbodiimid. Im allgemeinen arbeitet man bei einer Temperatur zwischen (-20) und 50°C, vorzugsweise zwischen 20 und 40°C in einem inerten organischen Lösungsmittel, wie Dichlormethan oder einem Ether wie Diethylether oder Methyl-tert.-butylether. Die Ausgangsmaterialien werden in etwa stöchiometrischer Menge zur Reaktion gebracht. Das Gemisch kann wie üblich aufgearbeitet werden, beispielsweise durch Hydrolyse mit Wasser, Extraktion des Produkts der Formel Ic ($R^2 = \text{CO-NR}^3\text{R}^4$) mit einem organischen Lösungsmittel und Einengen dieses organischen Lösungsmittels. Zur weiteren Reinigung kann das Produkt der Formel Ic ($R^2 = \text{CO-NR}^3\text{R}^4$) beispielsweise umkristallisiert oder chromatographiert werden.

Aus den so erhaltenen Isoxazolidicarbonsäure-4,5-diamiden der Formel Ic, in der X Sauerstoff und $R^2 = \text{CO-NR}^3\text{R}^4$ ($R^3, R^4 \neq \text{H}$) bedeuten, lassen sich die Carbonsäuren Ic ($R^2 = \text{COOH}$) durch Umsetzung mit überschüssigem Kalium-tert.-butylat herstellen. Dabei geht man zweckmäßigerweise so vor, daß man das Diamid Ic ($R^2 = \text{CO-NR}^3\text{R}^4$) in einem inerten organischen Lösungsmittel wie Diethylether oder Tetrahydrofuran bei Temperaturen von 0 bis 30°C, vorzugsweise bei Raumtemperatur, mit Kalium-tert.-butylat in Wasser (Verhältnis 3 bis 6:1) versetzt. Die Reaktion ist im allgemeinen nach 1 bis 12 Stunden beendet. Die freie Carbonsäure Ic ($R^2 = \text{COOH}$) kann nach Ansäuern mit Mineralsäure entweder durch Absaugen oder durch Extraktion mit einem organischen Lösungsmittel und Einengen dieses organischen Lösungsmittels isoliert werden. Zur weiteren Reinigung können die Säuren Ic ($R^2 = \text{COOH}$) entweder umkristallisiert oder chromatographiert werden.

Die für dieses Verfahren als Ausgangsmaterial benötigten Isothiazol-4,5-dicarbonsäureester X (X = Schwefel) sind bekannt (R. M. Paton, J. Stobie, R. M. Mortier, Phosphorus Sulfur, 15 (2), 137 (1983)) oder können nach an sich bekannten Methoden hergestellt werden.

Die für dieses Verfahren als Ausgangsmaterial benötigten Isoxazol-4,5-dicarbonsäuredialkylester X (X = Sauerstoff) sind literaturbekannt [J.Org.Chem. 43, 3736 (1978); Chem.Pharm.Bull. 28, 3296 (1980); Tetrahedron 30, 1365 (1974)] oder können nach allgemein literaturbekannten Methoden hergestellt werden [vgl. z.B. DE-A 27 54 832 und Synthesis, 508 (1982)], beispielsweise aus den Aldoximen XIII und Acetylendicarbonsäurediestern XIV:



Bei diesem Verfahren wird das Aldoxim XIII im Reaktionsmedium durch das Hypohalogenit zum entsprechenden Nitriloxid oxidiert, welches ein sehr reaktiver 1,3-Dipol ist. Dieses Nitriloxid wird vom ebenfalls im Reaktionsmedium vorliegenden Acetylendicarbonsäure-diester XIV laufend, wie es entsteht, in einer 1,3-dipolaren Cycloaddition unter Bildung der Isoxazolverbindung X abgefangen.

Zweckmäßigerweise werden äquimolare Mengen des Aldoxims XIII und des Acetylendicarbonsäure-diesters XIV mit dem Hypohalogenit umgesetzt. Das Hypohalogenit kann in stöchiometrischer Menge zur Reaktionsmischung gegeben werden. In der Regel wird es jedoch in leicht überschüssiger Menge, bis zu einem zweifachen Überschuß, zum Reaktionsansatz dosiert. Aus verfahrenstechnischen Gründen kann es ggf. vorteilhaft sein, den Umsatz durch Verwendung unterstöchiometrischer Mengen an Hypohalogenit - etwa 50 bis 90 mol-% Hypohalogenit pro mol XIII - zu begrenzen. Ebenso ist es möglich, mit unter- oder überstöchiometrischen Mengen der Reaktanten XIII oder XIV zu arbeiten.

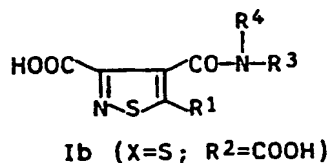
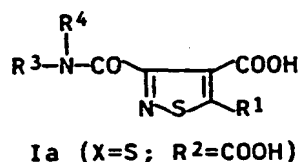
Als Hypohalogenite werden im allgemeinen Hypobromite und Hypochlorite, letztere bevorzugt, verwendet. Es können zu diesem Zweck wäßrige Lösungen der unterchlorigen oder unterbromigen Säure eingesetzt werden, vorzugsweise werden aber Alkalimetall- oder Erdalkalimetallhypochlorite oder -hypobromite, beispielsweise Natriumhypochlorit, Kaliumhypochlorit, Calciumhypochlorit, Magnesiumhypochlorit, Strontiumhypochlorit, Bariumhypochlorit oder die entsprechenden Hypobromite benutzt. Besonders bevorzugt werden Natrium-, Kalium- und Calciumhypochlorit und zwar in Form ihrer handelsüblichen, wäßrigen Lösungen angewandt.

Geeignete Lösungsmittel für das Verfahren sind z.B. Alkohole, wie Methanol, Ethanol, Propanol oder Isopropanol, Ketone wie Aceton oder Methyl-ethylketon, Ether wie Diethylether, Methyl-tert.-butylether, Tetrahydrofuran oder Dioxan, Kohlenwasserstoffe wie Pentan, Hexan, Cyclohexan, Petroether, Weißöle oder Ligroin, halogenierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Methylenchlorid, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff, Dichlorethan, Trichlorethan, Tetrachlorethan oder Perchlorethan, aromatische Verbindungen wie Benzol, Toluol, Xylole oder Chlorbenzole, Ester, wie Ethylacetat sowie Dimethylformamid, N-Methylpyrrolidon, Dimethylsulfoxid, Sulfolan usw.

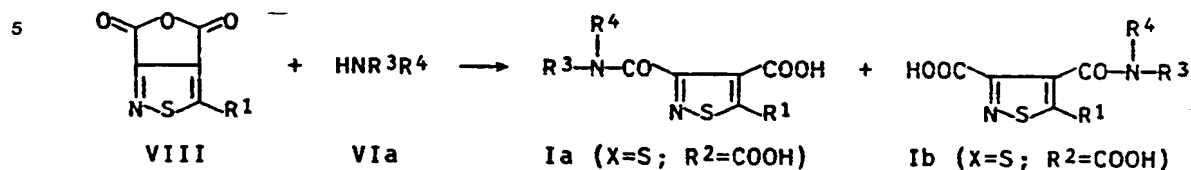
Die Temperatur, bei der die Umsetzung durchgeführt wird, kann in weiten Bereichen variiert werden. In der Regel findet die Umsetzung schon bei Temperaturen von (-15)° C und tiefer statt, und nach oben wird der Temperaturbereich im Prinzip nur durch den Siedepunkt des verwendeten Lösungsmittel begrenzt, da die Umsetzung zweckmäßigerweise bei Atmosphärendruck ausgeführt wird. Vorzugsweise wird bei Temperaturen im Bereich von 0 bis 40° C gearbeitet. Die Reaktion kann auch unter erhöhtem Druck ausgeführt werden, insbesondere unter autogen erzeugtem Druck, bevorzugt ist aber das Arbeiten bei Atmosphärendruck.

Die für dieses Verfahren benötigten Aldoxime XIII sind entweder bekannt oder können nach an sich bekannten Verfahren (z. B. Houben-Weyl, Methoden der organischen Chemie, Bd. 10/4, Seite 55 bis 56, Thieme Verlag, Stuttgart 1968) durch Umsetzung der entsprechenden Aldehyde mit Hydroxylamin, hergestellt werden. Die Aldoxime XIII können selbstverständlich sowohl in Form ihrer E- oder Z-Isomeren als auch als Gemische dieser Stereoisomeren verwendet werden. Die Acetylendicarbonsäure-diester sind im Handel erhältlich oder nach an sich bekannten Methoden (z.B. Organic Syntheses Coll. Vol. 4, Seite 329) darstellbar.

6. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen Ia und Ib, in denen R² eine Carboxylgruppe und X Schwefel bedeuten:



Man erhält diese Carbonsäureamide Ia und Ib besonders vorteilhaft, indem man ein Isothiazoldicarbonsäureanhydrid VIII in an sich bekannter Weise mit einem Amin VIa umsetzt und das so erhaltene Gemisch der Isomeren Ia und Ib in die Einzelkomponenten trennt.



Die Umsetzung wird üblicherweise bei Temperaturen von (-10) bis 50° C, vorzugsweise 0 bis 30° C in einem inerten aprotisch polaren organischen Lösungsmittel durchgeführt.

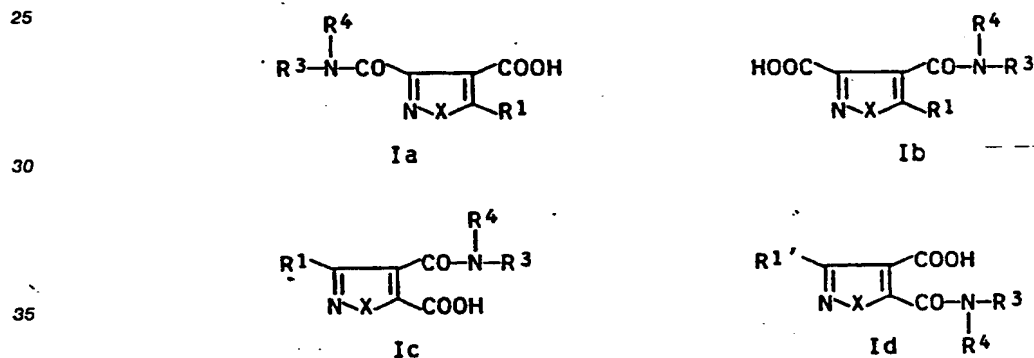
Insbesondere finden als Lösungsmittel Halogenkohlenwasserstoffe wie Methylenchlorid und Ether wie Diethylether, tert.-Butyl-methylether und Tetrahydrofuran Anwendung.

Das Amin VIa wird im allgemeinen in äquimolaren Mengen oder im Überschuß, vorzugsweise in Mengen von 1 bis 1,2 mol-äq. bezogen auf VIII eingesetzt.

Bei diesem Verfahren entstehen die isomeren Carbonsäureamide der Formeln Ia und Ib (R²=COOH) in unterschiedlichen Mengen. Die Auftrennung des Isomerengemischs gelingt entweder durch fraktionierte Kristallisation oder auf chromatographischem Wege.

Die für dieses Verfahren benötigten Isothiazoldicarbonsäureanhydride VIII sind bekannt oder können nach bekannten Methoden hergestellt werden (Beilstein, Hauptwerk und 1.-5. Ergänzungswerk, Band 27).

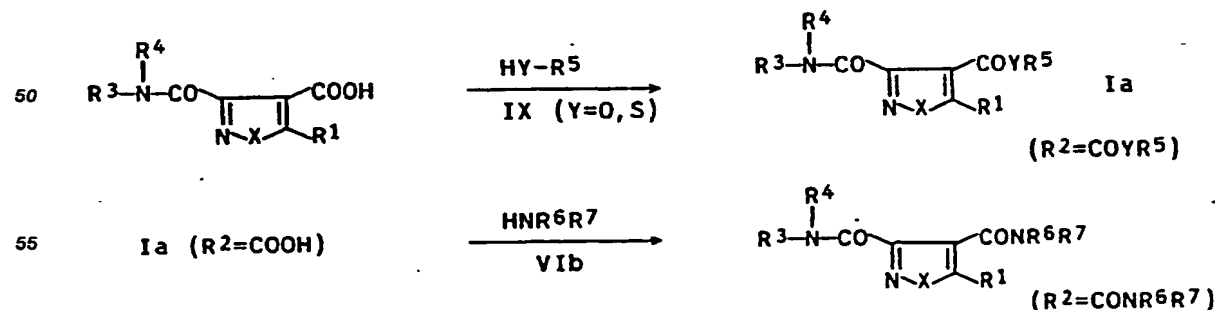
7. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen Ia, Ib, Ic und Id, in denen R² CO₂H bedeutet:



Man erhält diese Verbindungen Ia, Ib, Ic und Id dadurch, daß man einen entsprechenden Ester Ia, Ib, Ic oder Id, in dem R² eine Gruppe CO₂R⁵ und R⁵ C₁-C₄-Alkyl bedeutet, in an sich bekannter Weise in Gegenwart einer wäßrigen Base hydrolysiert.

Diese Esterhydrolyse wird im allgemeinen und im besonderen entsprechend den bei Verfahren 2 unter Punkt B geschilderten Bedingungen durchgeführt.

8. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen Ia, Ib, Ic und Id, in denen R² COYR⁵ oder CONR⁶R⁷ bedeutet (beispielhaft für die Carbonsäureamide Ia gezeigt):



Zweckmäßigerweise setzt man eine Carbonsäure Ia, Ib, Ic bzw. Id ($R^2 = \text{COOH}$) mit einem Alkohol oder Thiol IX bzw. mit einem Amin VIb in Gegenwart eines wasserentziehenden Mittels, z. B. Propanphosphonsäureanhydrid (PPA) oder Dicyclohexylcarbodiimid (DCC) bei einer Temperatur zwischen (-20) und 50°C , vorzugsweise zwischen 0 und 40°C , insbesondere zwischen 20 und 30°C , um.

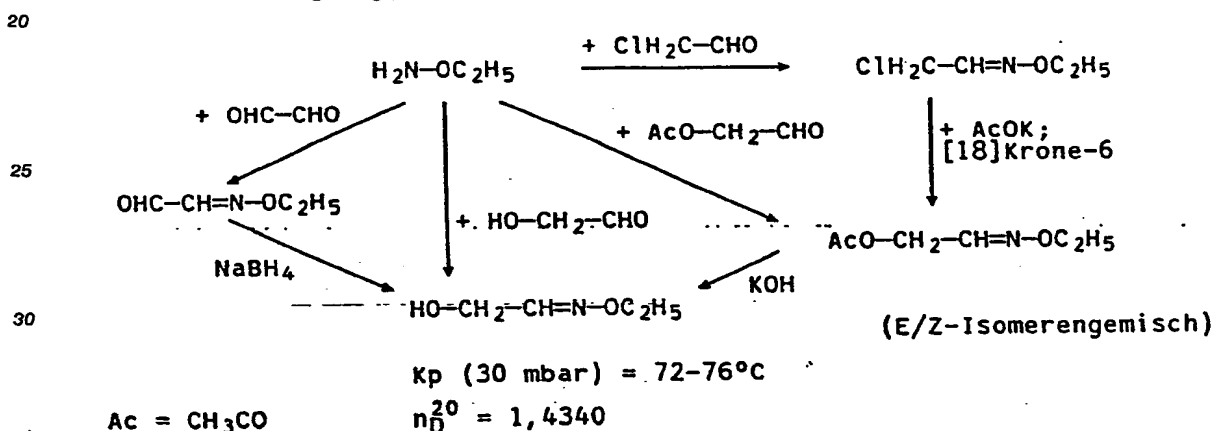
5 Vorteilhaft setzt man alle Ausgangsverbindungen in etwa stöchiometrischem Verhältnis ein, jedoch kann in manchen Fällen auch ein Überschuß der einen oder anderen Komponente, etwa bis zu 10 mol-%, empfehlenswert sein.

Zweckmäßig verwendet man als Lösungsmittel Kohlenwasserstoffe wie Toluol und o-, m-, p-Xylol, Halogenkohlenwasserstoffe wie Dichlormethan und Ether wie Diethylether, tert.-Butyl-methylether und Tetrahydrofuran.

Eine Verfahrensvariante besteht darin, die Carbonsäuren Ia, Ib, Ic oder Id ($R^2 = \text{COOH}$) nach den für das Verfahren 1C gemachten Angaben zu aktivieren und die Verfahrensprodukte anschließend ohne Verwendung eines wasserentziehenden Mittels zu verestern oder zu amidieren.

Normalerweise arbeitet man bei Atmosphärendruck.

15 Die Amine VIb sind bekannt oder lassen sich nach bekannten Verfahren herstellen. Die Alkohole und Thiole HY-R⁵ sind teilweise bekannt. Bedeutet R⁵ eine durch einen Rest -CR¹⁰=N-R¹¹ substituierte C₁-C₆-Alkylgruppe (Iminoalkohole XVI), so sind diese Alkohole und Thiole neu; sie lassen sich aber nach einem der folgenden bekannten Verfahren herstellen (beispielhaft für Y = O und R⁵ = -CH₂-CR¹⁰=N-R¹¹ mit R¹⁰ = H und R¹¹ = C₂H₅ gezeigt):

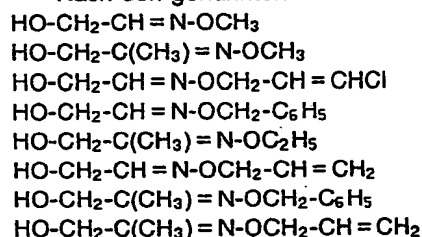


Ac = CH₃CO

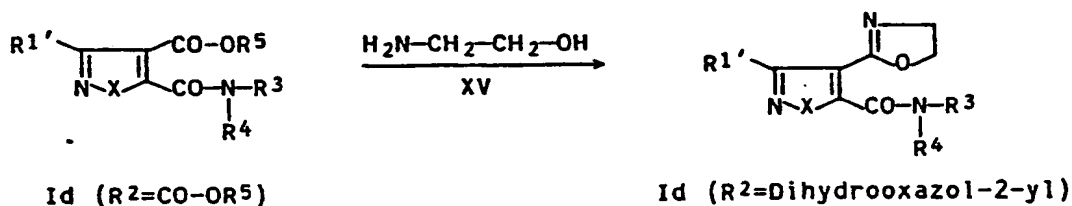
Kp (30 mbar) = 72-76°C

$$n_D^{20} = 1,4340$$

Nach den genannten Verfahren wurden z.B. die folgenden Alkohole hergestellt:



45 9. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen Ia, Ib, Ic und Id, in denen R² 4,5-Dihydrooxazol-2-yl bedeutet, durch an sich bekannte Umsetzung von Carbonsäureamiden Ia, Ib, Ic bzw. Id, wobei R² COOH oder COOR⁵ (R⁵ = geg. subst. C₁-C₄-Alkyl wie unter den Resten R⁵ aufgeführt) bedeutet, mit einem Aminoalkohol der Formel XV [vgl. Wehrmeister, J.Org.Chem. 26, 3821 (1961)]:



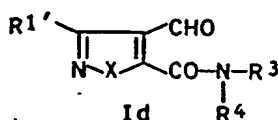
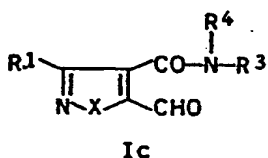
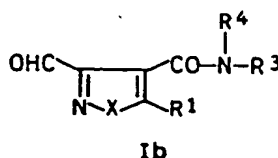
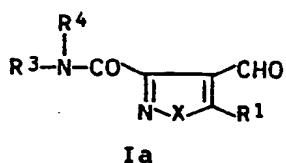
Die Reaktion wird so durchgeführt, daß man die Verbindungen bei 0 bis 180 °C, vorzugsweise bei Rückflußtemperatur des verwendeten Gemisches mit einem Aminoalkohol XV, gegebenenfalls in Gegenwart eines inerten Lösungsmittels, umsetzt. Ester oder Carbonsäure und Aminoalkohol XV werden dabei im Verhältnis 1:1 bis 1:2,5, vorzugsweise 1:1 bis 1:1,5 eingesetzt.

Als Lösungsmittel verwendet man zweckmäßigerweise Halogenkohlenwasserstoffe wie Chlorbenzol und 1,2-Dichlorbenzol, Ether, z.B. Methyl-tert.-butylether, 1,2-Dimethoxyethan, Diethylenglykol-dimethylether, Tetrahydrofuran und Dioxan, Alkohole wie Methanol, Ethanol, Propanol oder Ethylenglykol, dipolare aprotische Lösungsmittel, z.B. Acetonitril, Dimethylformamid, Dimethylacetamid, Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon, 1,3-Dimethyltetrahydro-2(1H)-pyrimidinon und 1,3-Dimethylimidazolin-2-on oder Aromaten, z.B. Benzol, Toluol und Xylol. Die Konzentration der Edukte im Lösungsmittel beträgt im allgemeinen 0,1 bis 5,0 mol/l, bevorzugt 0,2 bis 2,0 mol/l.

Die Umsetzung ist im allgemeinen nach 14 Stunden beendet; die Carbonsäureamide Ia, Ib, Ic bzw. Id (mit R² = 4,5-Dihydrooxazol-2-yl) werden dann gegebenenfalls durch Zugabe von Wasser ausgefällt, abgesaugt oder mit einem organischen Lösungsmittel extrahiert und mit üblichen Standardmethoden wie Umkristallisation oder Chromatographie gereinigt.

Im allgemeinen arbeitet man bei Atmosphärendruck oder unter dem Eigendruck des jeweiligen Lösungsmittels.

10. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen Ia, Ib, Ic und Id, in denen R² Formyl bedeutet:



Man erhält diese Verbindungen Ia, Ib, Ic und Id beispielsweise dadurch, daß man ein entsprechendes Carbonsäureamid der Formel Ia, Ib, Ic bzw. Id, wobei R² eine Gruppe CO₂H bedeutet, gemäß den bei Verfahren 1 geschilderten Bedingungen aktiviert und die so erhaltene aktivierte Form der Carbonsäure in an sich bekannter Weise reduziert.

Vorzugsweise überführt man die Carbonsäure in das entsprechende Chlorid und reduziert dieses Carbonsäurechlorid bei Temperaturen von (-100) bis 0 °C, insbesondere (-80) bis (-50) °C mit einem komplexen Hydrid wie insbesondere Lithium-tri-tert.-butoxyaluminiumhydrid. Als Lösungsmittel dienen in diesem Fall besonders bevorzugt Ether wie Dimethylether, Diethylether, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, Diethylenglykoldimethylether und Dioxan (J.Am.Chem. Soc. 80, 5372 (1958); J.Am.Chem.Soc. 80, 5377 (1958)).

11. Verbindungen der Formeln Ia, Ib, Ic und Id, in denen R¹ bzw. R^{1'} eine epoxidierte C₂-C₆-Alkenylgruppe bedeuten, die ein- bis dreimal durch Halogen, C₁-C₃-Alkoxy und/oder einmal durch Cyclopropyl oder geg. subst. Phenyl wie unter R¹ genannt, substituiert sein kann, erhält man beispielsweise durch Epoxidierung von Carbonsäureamiden der Formeln Ia, Ib, Ic bzw. Id, wobei R¹ bzw. R^{1'} eine C₂-C₆-Alkenylgruppe bedeutet, die die vorstehend genannten Substituenten tragen kann, in an sich bekannter Weise mit geeigneten Oxidationsmitteln (z.B. J. March, Advanced Organic Chemistry, Third Edition, John Wiley and Sons, 1985, S. 735ff.).

Neben den vorstehend geschilderten Verfahren 1-11 zur Herstellung der Verbindungen Ia, Ib, Ic und Id gibt es weitere Synthesemöglichkeiten, die den folgenden Literaturstellen zu entnehmen sind:

Beilstein, Hauptwerk sowie 1.-5. Ergänzungswerk, Band 27;

R.W. Wiley, The Chemistry of Heterocyclic Compounds, Five- and Six-Membered Compounds with Nitrogen and Oxygen, Interscience Publishers, New York, London (1962);

A.R. Katritzky, C.W. Rees, Comprehensive Heterocyclic Chemistry, Vol. 6, Five-membered Rings with Two or More Oxygen, Sulfur or Nitrogen Atoms, Pergamon Press, 1984;

J. March, Advanced Organic Chemistry, Third Edition, John Wiley and Sons, 1985;

Houben-Weyl, Methoden der organischen Chemie, 4. Auflage, Thieme Verlag, Bände IV, VI, VII, VIII, X.

Im einzelnen haben die Substituenten in den Verbindungen Ia, Ib, Ic und Id die folgende Bedeutung:

R¹ - Wasserstoff;

- Halogen wie Fluor, Chlor, Brom, Iod, insbesondere Fluor und Chlor;

- 5 - unverzweigtes oder verzweigtes C₁-C₆-Alkyl wie Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 1-Methylpropyl, 2-Methylpropyl, 1,1-Dimethylethyl, Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 2,2-Dimethylpropyl; 1-Ethylpropyl, Hexyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl, 2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1,2,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl und 1-Ethyl-2-methylpropyl, insbesondere Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl und 1,1-Dimethylethyl, welches ein bis fünf Halogenatome wie Fluor, Chlor, Brom, Iod, insbesondere Fluor und Chlor, und/oder einen Cyano- und/oder bis zu zwei der folgenden Reste tragen kann:

- (C₁-C₄-Alkoxy wie Methoxy, Ethoxy, Propoxy, 1-Methylethoxy, Butoxy, 1-Methylpropoxy, 2-Methylpropoxy und 1,1-Dimethylethoxy, insbesondere Methoxy, Ethoxy, 1-Methylethoxy und 1,1-Dimethylethoxy;

- 15 - partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₄-Alkoxy wie Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Chlordifluormethoxy, Dichlorfluormethoxy, 1-Fluorethoxy, 2-Fluorethoxy, 2,2-Difluorethoxy, 1,1,2,2-Tetrafluorethoxy, 2,2,2-Trifluorethoxy, 2-Chlor-1,1,2-trifluorethoxy und Pentafluorethoxy, insbesondere Trifluormethoxy und Pentafluorethoxy;

- C₁-C₄-Alkylthio wie Methylthio, Ethylthio, Propylthio, 1-Methylethylthio, n-Butylthio, 1-Methylpropylthio, 2-Methylpropylthio und 1,1-Dimethylethylthio, insbesondere Methylthio und Ethylthio;

- 20 - partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₄-Alkylthio wie Difluormethylthio, Trifluormethylthio, Chlordifluormethylthio, 1-Fluorethylthio, 2-Fluorethylthio, 2,2-Difluorethylthio, 2,2,2-Trifluorethylthio, 2-Chlor-2,2-difluorethylthio, 2,2-Dichlor-2-fluorethylthio, 2,2,2-Trichlorethylthio und Pentafluorethylthio, insbesondere Trifluormethylthio und Pentafluorethylthio;

- 25 - eine C₁-C₄-Alkoxygruppe wie vorstehend genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy;

- eine partiell oder vollständig halogenierte C₁-C₄-Alkoxygruppe wie vorstehend genannt, insbesondere Trifluormethoxy, Trichlormethoxy und Pentafluorethoxy;

- eine C₁-C₄-Alkylthiogruppe wie vorstehend genannt, insbesondere Methylthio und Ethylthio;

- 30 - eine partiell oder vollständig halogenierte C₁-C₄-Alkylthiogruppe wie vorstehend genannt, insbesondere Difluormethylthio, Trifluormethylthio und Pentafluorethylthio;

- eine Benzylgruppe, die ein bis dreimal durch Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen wie vorstehend genannt, insbesondere Methyl, Ethyl und 1-Methylethyl; Halogenalkyl wie vorstehend genannt, insbesondere Trifluormethyl und Chlordifluormethyl; Alkoxy wie vorstehend genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogenalkoxy wie vorstehend genannt, insbesondere Trifluormethoxy, Trichlormethoxy und Pentafluorethoxy;

- 35 - Alkylthio wie vorstehend genannt, insbesondere Methylthio und Ethylthio; Halogenalkylthio wie vorstehend genannt, insbesondere Difluormethylthio, Trifluormethylthio und Pentafluormethylthio; Halogen wie vorstehend genannt, insbesondere Fluor und Chlor; Cyano oder Nitro substituiert sein kann;

- die Phenylgruppe, welche noch einen bis drei der folgenden Reste tragen kann: Cyano; Nitro; Halogen wie Fluor, Chlor, Brom und Jod, insbesondere Fluor und Chlor; C₁-C₆-Alkyl wie vorstehend genannt, insbesondere Methyl, Ethyl und 1-Methylethyl; partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₆-Alkyl wie vorstehend genannt, insbesondere Trifluormethyl und Chlordifluormethyl; C₁-C₆-Alkoxy wie vorstehend genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₆-Alkoxy wie vorstehend genannt, insbesondere Trifluormethoxy, Trichlormethoxy und Pentafluorethoxy; C₁-C₄-Alkylthio wie vorstehend genannt, insbesondere Methylthio und Ethylthio und/oder partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₆-Alkylthio wie vorstehend genannt, insbesondere Difluormethylthio, Trifluormethylthio und Pentafluormethylthio;

- 40 - eine C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-C₆-alkylgruppe, bevorzugt eine C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkylgruppe wie Cyclopropylmethyl, Cyclopentylmethyl, Cyclohexylmethyl, 1-Cyclopropylethyl, 2-Cyclopropylethyl, 1-Cyclopropyl-1-methylethyl, 2-Cyclopropyl-1-methylethyl oder 4-Cyclohexyl-n-butyl;

- 50 - eine C₂-C₆-Alkenylgruppe, deren Doppelbindung epoxidiert sein kann, bevorzugt eine C₂-C₄-Alkenylgruppe wie Ethenyl, Prop-2-en-1-yl, 1-Methylethenyl, But-2-en-1-yl und 1-Methylprop-2-en-1-yl, welche ein- bis dreimal durch Halogen wie Fluor, Chlor, Brom oder Jod, C₁-C₃-Alkoxy wie Methoxy, Ethoxy oder Isopropoxy und/oder einmal durch Cyclopropyl oder Phenyl substituiert sein kann, wobei der Phenylrest seinerseits eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Cyano, Nitro, Alkyl wie vorstehend genannt, insbesondere Methyl, Ethyl und 1-Methylethyl; Halogenalkyl wie vorstehend genannt, insbesondere Trifluormethyl und Chlordifluormethyl; Alkoxy wie vorstehend genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogenalkoxy wie vorstehend genannt, insbesondere Trifluormethoxy, Trichlormethoxy und Pentafluorethoxy; Alkylthio wie vorstehend genannt, insbesondere Methylthio und Ethylthio; partiell oder vollständig halogen-

niertes Alkylthio wie vorstehend genannt, insbesondere Difluormethylthio, Trifluormethylthio und Pentafluormethylthio oder Halogen wie vorstehend genannt, insbesondere Fluor und Chlor;

- eine C₂-C₆-Alkynylgruppe, bevorzugt eine C₂-C₄-Alkynylgruppe wie Ethinyl, Propin-1-yl, 1-Methyl-2-propinyl und n-Butinyl, welche ein- bis dreimal durch Halogen wie Fluor, Chlor, Brom oder Jod, C₁-C₃-Alkoxy wie Methoxy oder Isopropoxy und/oder einmal durch Cyclopropyl oder Phenyl substituiert sein kann, wobei der Phenylrest seinerseits eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Cyano, Nitro, Alkyl wie vorstehend genannt, insbesondere Methyl, Ethyl und 1-Methylethyl; Halogenalkyl wie vorstehend genannt, insbesondere Trifluormethyl und Chlordifluormethyl; Alkoxy wie vorstehend genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogenalkoxy wie vorstehend genannt, insbesondere Trifluormethoxy, Trichlormethoxy und Pentafluorethoxy; Alkylthio wie vorstehend genannt, insbesondere Methylthio und Ethylthio; partiell oder vollständig halogeniertes Alkylthio wie vorstehend genannt, insbesondere Difluormethylthio, Trifluormethylthio und Pentafluormethylthio oder Halogen wie vorstehend genannt, insbesondere Fluor und Chlor;

- eine C₃-C₈-Cycloalkylgruppe wie Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl und Cyclooctyl, insbesondere Cyclopropyl, Cyclopentyl und Cyclohexyl oder eine C₃-C₆-Cycloalkenylgruppe, insbesondere eine C₅-C₆-Cycloalkenylgruppe wie Cyclohexen-1-yl, wobei der Cyclohexen-Ring noch ein- bis dreimal durch C₁-C₄-Alkyl wie vorstehend genannt, insbesondere Methyl und Ethyl; oder Halogen wie Fluor, Chlor, Brom und Jod, insbesondere Fluor und Chlor, substituiert sein kann;

- eine Phenoxy- oder Phenylthiogruppe, wobei beide Gruppen ein- bis dreimal durch C₁-C₄-Alkyl wie vorstehend genannt, insbesondere Methyl, Ethyl und 1-Methylethyl; partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₄-Alkyl wie vorstehend genannt, insbesondere Trifluormethyl und Chlordifluormethyl; C₁-C₄-Alkoxy wie vorstehend genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₄-Alkoxy wie vorstehend genannt, insbesondere Trifluormethoxy, Trichlormethoxy und Pentafluorethoxy; C₁-C₄-Alkylthio wie vorstehend genannt, insbesondere Methylthio und Ethylthio; partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₄-Alkylthio wie vorstehend genannt, insbesondere Difluormethylthio, Trifluormethylthio und Pentafluormethylthio; Halogen wie vorstehend genannt, insbesondere Fluor und Chlor; Cyano oder Nitro; substituiert sein kann;

- ein 5- bis 6-gliedriger gesättigter oder aromatischer heterocyclischer Rest, enthaltend ein oder zwei Heteroatome, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff wie 2-Tetrahydrofuranyl, 3-Tetrahydrofuranyl, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Tetrahydrothienyl, 2-Tetrahydropyran-2-yl, 3-Tetrahydropyran-3-yl, 4-Tetrahydropyran-4-yl, 2-Furanyl, 3-Furanyl, 2-Thienyl, 3-Thienyl, 3-Isoxazolyl, 4-Isoxazolyl, 5-Isoxazolyl, 3-Isothiazolyl, 4-Isothiazolyl, 5-Isothiazolyl, 2-Oxazolyl, 4-Oxazolyl, 5-Oxazolyl, 2-Thiazolyl, 4-Thiazolyl, 5-Thiazolyl, 2-Imidazolyl, 4-Imidazolyl, 5-Imidazolyl, 2-Pyrrolyl, 3-Pyrrolyl, 3-Pyrazolyl, 4-Pyrazolyl, 5-Pyrazolyl, 2-Pyridyl, 3-Pyridyl und 4-Pyridyl, der ein oder zwei der folgenden Substituenten tragen kann: Alkyl wie vorstehend genannt, insbesondere Methyl; Halogen wie vorstehend genannt, insbesondere Fluor und Chlor; Alkoxy wie vorstehend genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; oder Alkoxycarbonyl wie Methoxycarbonyl und Ethoxycarbonyl, insbesondere Methoxycarbonyl;

R¹ - eine C₃-C₈-Cycloalkyl-C₁-C₆-alkylgruppe, bevorzugt eine C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkylgruppe wie Cyclopropylmethyl, Cyclopentylmethyl, Cyclohexylmethyl, 1-Cyclopropylethyl, 2-Cyclopropylethyl, 1-Cyclopropyl-1-methylethyl, 2-Cyclopropyl-1-methylethyl und 4-Cyclohexyl-n-butyl;

- eine C₂-C₆-Alkenylgruppe, deren Doppelbindung epoxidiert sein kann, bevorzugt eine C₂-C₄-Alkenylgruppe wie Ethenyl, Prop-2-en-1-yl und Isopropenyl, welche ein- bis dreimal durch Halogen wie Fluor, Chlor, Brom oder Jod, C₁-C₃-Alkoxy wie Methoxy, Ethoxy oder Isopropoxy und/oder einmal durch Cyclopropyl oder Phenyl substituiert sein kann, wobei der Phenylrest seinerseits eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Cyano, Nitro, Alkyl wie vorstehend genannt, insbesondere Methyl, Ethyl und 1-Methylethyl; Halogenalkyl wie vorstehend genannt, insbesondere Trifluormethyl und Chlordifluormethyl; Alkoxy wie vorstehend genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogenalkoxy wie vorstehend genannt, insbesondere Trifluormethoxy, Trichlormethoxy und Pentafluorethoxy; Alkylthio wie vorstehend genannt, insbesondere Methylthio und Ethylthio; partiell oder vollständig halogeniertes Alkylthio wie vorstehend genannt, insbesondere Difluormethylthio, Trifluormethylthio und Pentafluormethylthio oder Halogen wie vorstehend genannt, insbesondere Fluor und Chlor;

- eine C₂-C₆-Alkynylgruppe, bevorzugt eine C₂-C₄-Alkynylgruppe wie Ethinyl, Propin-1-yl und n-Butinyl, welche ein- bis dreimal durch Halogen wie Fluor, Chlor, Brom und Jod, insbesondere Fluor und Chlor, C₁-C₃-Alkoxy wie Methoxy und Isopropoxy und/oder einmal durch Cyclopropyl oder Phenyl substituiert sein kann, wobei der Phenylrest seinerseits eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Cyano, Nitro, Alkyl wie vorstehend genannt, insbesondere Methyl, Ethyl und 1-Methylethyl; Halogenalkyl wie vorstehend genannt, insbesondere Trifluormethyl und Chlordifluormethyl; Alkoxy wie vorstehend genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogenalkoxy wie vorstehend genannt, insbesondere Trifluormethoxy, Trichlormethoxy und Pentafluorethoxy; Alkylthio wie vorstehend genannt, insbesondere Methylthio und Ethylthio;

partiell oder vollständig halogeniertes Alkylthio wie vorstehend genannt, insbesondere Difluormethylthio, Trifluormethylthio und Pentafluormethylthio oder Halogen wie vorstehend genannt, insbesondere Fluor und Chlor;

- eine C₃-C₆-Cycloalkenylgruppe, bevorzugt eine C₅-C₆-Cycloalkenylgruppe, die ein- bis dreimal durch
- 5 Halogen wie Fluor, Chlor, Brom und Jod, insbesondere Fluor und Chlor, oder C₁-C₄-Alkyl wie Methyl, Ethyl und tert.-Butyl substituiert sein kann;
- R² - die Formylgruppe;
- die 4,5-Dihydrooxazol-2-ylgruppe;
- ein Rest COYR⁵ oder CONR⁶R⁷ mit
- 10 R⁵ - Wasserstoff;
- C₁-C₆-Alkyl, bevorzugt C₁-C₄-Alkyl wie Methyl, Ethyl oder tert.-Butyl, welches ein bis fünf Halogenatome wie Fluor, Chlor, Brom oder Jod, insbesondere Fluor und Chlor, und/oder bis zu drei Hydroxy- und/oder C₁-C₄-Alkoxygruppen wie Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, Isopropoxy, n-Butoxy und tert.-Butoxy, und/oder einen der folgenden Reste tragen kann:
- 15 - Cyano,
- C₁-C₄-Alkoxy-C₂-C₄-alkoxy, insbesondere Methoxy-ethoxy, Ethoxy-ethoxy und Propoxy-ethoxy,
- C₁-C₃-Alkylthio, insbesondere Methylthio und Ethylthio,
- C₁-C₃-Alkylamino wie Methylamino, Ethylamino und Isopropylamino,
- Di-(C₁-C₃)-alkylamino wie Dimethylamino, Diethylamino, Dipropylamino, Di-(1-methylethyl)amino und
- 20 Methyllethylamino,
- C₃-C₆-Cycloalkylamino oder Di-(C₃-C₆)-Cycloalkylamino wie Cyclopropylamino oder Dicyclopropylamino,
- Trimethylsilyl,
- C₁-C₃-Alkylsulfinyl wie Methylsulfinyl, 1-Methylethylsulfinyl und n-Propylsulfinyl,
- C₁-C₃-Alkylsulfonyl wie Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl und Isopropylsulfonyl,
- 25 - Carboxyl,
- C₁-C₃-Alkoxy-carbonyl wie Methoxycarbonyl und Isopropoxycarbonyl,
- C₁-C₃-Alkoxy-carbonyl-C₁-C₃-alkoxy wie Methoxycarbonylmethoxy,
- C₁-C₃-Alkoxy-carbonyl-C₁-C₃-alkoxy-C₁-C₃-alkoxy-carbonyl wie Methoxycarbonylethoxymethoxycarbonyl,
- Di-(C₁-C₃)-alkylaminocarbonyl wie Dimethylaminocarbonyl, Methyllethylaminocarbonyl und Di-isopropylaminocarbonyl,
- 30 - Di-(C₁-C₃)-alkoxyphosphonyl wie Dimethoxyphosphonyl und Diisopropoxyphosphonyl,
- C₁-C₆-Alkaniminoxy wie 2-Propaniminoxy oder C₅-C₆-Cycloalkaniminoxy wie Cyclopentaniminoxy und Cyclohexaniminoxy
- N-Phthalimido, N-Succinimido, Benzyloxy oder Benzoyl, wobei diese cyclischen Reste ein bis drei der
- 35 folgenden Gruppen tragen können: Halogen wie vorstehend genannt, insbesondere Fluor und Chlor, C₁-C₃-Alkyl wie Methyl, Ethyl und Isopropyl, insbesondere Methyl, oder C₁-C₃-Alkoxy wie Methoxy, Ethoxy und Isopropoxy, insbesondere Methoxy;
- einen 5- oder 6-gliedrigen gesättigten heterocyclischen Rest oder einen 5- oder 6-gliedrigen heteroaromatischen Rest mit jeweils 1. bis 3 Heteroatomen, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel und
- 40 Stickstoff, wobei zwei Sauerstoff- oder Schwefelatome oder ein Sauerstoff und ein Schwefelatom nicht direkt benachbart sein können, insbesondere Tetrahydrofuran-2-yl, Tetrahydrofuran-3-yl, Tetrahydrothien-2-yl, Tetrahydrothien-3-yl, Tetrahydropyran-2-yl, Tetrahydropyran-3-yl, Tetrahydropyran-4-yl, Pyrrolidin-2-yl, Pyrrolidin-3-yl, Furan-2-yl, Furan-3-yl, Thien-2-yl, Thien-3-yl, Pyrrol-2-yl, Pyrrol-3-yl, Isoxazol-3-yl, Isoxazol-4-yl, Isoxazol-5-yl, Isothiazol-3-yl, Isothiazol-4-yl, Isothiazol-5-yl, Oxazol-2-yl, Oxazol-4-yl, Oxazol-5-yl,
- 45 Thiazol-2-yl, Thiazol-4-yl, Thiazol-5-yl, Imidazol-2-yl, Imidazol-4-yl, Imidazol-5-yl, Pyrazol-1-yl, Pyrazol-3-yl, Pyrazol-4-yl, Pyrazol-5-yl, 1,2,3-Triazol-1-yl, 1,2,3-Triazol-4-yl, 1,2,3-Triazol-5-yl, 1,2,4-Triazol-1-yl, 1,2,4-Triazol-3-yl, 1,2,4-Triazol-5-yl, 1,2,3-Thiadiazol-4-yl, 1,2,3-Thiadiazol-5-yl, 1,2,4-Thiadiazol-3-yl, 1,2,4-Thiadiazol-5-yl, 1,2,5-Thiadiazol-3-yl, 1,2,5-Thiadiazol-4-yl, 1,3,4-Thiadiazol-2-yl, 1,3,4-Thiadiazol-5-yl, 1,2,3-Oxadiazol-3-yl, 1,2,3-Oxadiazol-5-yl, 1,2,4-Oxadiazol-3-yl, 1,2,4-Oxadiazol-5-yl, 1,2,5-Oxadiazol-3-yl, 1,2,5-Oxadiazol-4-yl, 1,3,4-Oxadiazol-2-yl, 1,3,4-Oxadiazol-5-yl, Pyrid-2-yl, Pyrid-3-yl, Pyrid-4-yl, Pyrimid-2-yl,
- 50 Pyrimid-4-yl und Pyrimid-5-yl, wobei die Heterocyclen noch einen oder zwei der folgenden Substituenten tragen können: Halogen wie Fluor, Chlor, Brom und Jod, insbesondere Chlor und Brom, C₁-C₃-Alkyl wie Methyl, Ethyl, n-Propyl und iso-Propyl, C₁-C₃-Alkoxy wie Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy und iso-Propoxy und/oder C₁-C₃-Alkoxy-carbonyl wie Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl und iso-Propoxycarbonyl;
- 55 - die Phenylgruppe, die noch einen bis drei der folgenden Substituenten tragen kann: Halogen wie Fluor, Chlor, Brom und Jod, insbesondere Fluor und Chlor, Nitro, Cyano, C₁-C₃-Alkyl wie Methyl oder Isopropyl, partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₃-Alkyl wie Trifluormethyl, 1,1,2,2-Tetrafluorethyl und Trichlormethyl, C₁-C₃-Alkoxy wie Methoxy und Isopropoxy, und/oder partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₃-

Alkoxy, insbesondere Trifluormethoxy;

- einen Rest $-CR^{10} = N-R^{11}$ mit

R^{10} Wasserstoff oder verzweigtes oder unverzweigtes C_1 - C_6 -Alkyl, insbesondere C_1 - C_4 -Alkyl wie Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl und tert.-Butyl;

5 R^{11} C_1 - C_6 -Alkoxy, C_3 - C_6 -Alkenyloxy oder C_3 - C_6 -Alkinyloxy, insbesondere C_1 - C_4 -Alkoxy wie Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, iso-Propoxy, n-Butoxy und tert.-Butoxy, sowie Prop-2-enyloxy, But-2-enyloxy, Prop-2-inyloxy und But-2-inyloxy, wobei diese Substituenten noch ein bis drei Halogenatome wie Fluor, Chlor, Brom und Iod, insbesondere Fluor und Chlor, und/oder einen Phenylrest, der unsubstituiert oder ein- bis dreifach durch Halogen wie vorstehend genannt, Nitro, Cyano, C_1 - C_3 -Alkyl wie Methyl, Ethyl, n-Propyl und iso-Propyl und/oder C_1 - C_3 -Alkoxy wie Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy und iso-Propoxy substituiert sein kann, tragen können;

Phenoxy, das noch einen bis drei der folgenden Substituenten tragen kann: Nitro, Cyano, Halogen wie vorstehend genannt, C_1 - C_3 -Alkyl wie vorstehend genannt und/oder C_1 - C_3 -Alkyl wie vorstehend genannt; verzweigtes oder unverzweigtes C_1 - C_6 -Alkylamino, Di-(C_1 - C_6)-alkylamino oder Phenylamino, wobei der

15 Aromat zusätzlich ein- bis dreifach durch Nitro, Cyano, Halogen wie vorstehend genannt, C_1 - C_3 -Alkyl wie vorstehend genannt und/oder C_1 - C_3 -Alkoxy wie vorstehend genannt, substituiert sein kann;

- C_3 - C_6 -Cycloalkyl, bevorzugt C_3 - C_6 -Cycloalkyl wie Cyclopropyl, Cyclopentyl und Cyclohexyl;

- C_3 - C_6 -Alkenyl, bevorzugt C_3 - C_4 -Alkenyl wie 2-Propenyl und 2-Butenyl, C_5 - C_6 -Cycloalkenyl wie 2-Cyclopentenyl und 2-Cyclohexenyl, C_3 - C_6 -Alkynyl, bevorzugt C_3 - C_4 -Alkenyl wie 2-Propinyl, 2-Butinyl und 3-

20 Butinyl, wobei die 3 letztgenannten Gruppen einen der folgenden Reste tragen können: Hydroxy, Halogen wie Fluor, Chlor, Brom und Jod, C_1 - C_4 -Alkoxy wie Methoxy und tert.-Butoxy oder Phenyl, welches seinerseits eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Halogen wie Fluor, Chlor oder Brom, Nitro, Cyano, C_1 - C_4 -Alkyl wie Methyl, Ethyl oder tert.-Butyl, C_1 - C_4 -Halogenalkyl wie Fluormethyl, Trifluormethyl, Chlordifluormethyl, Pentafluorethyl und 2-Chlor-1,1,2-trifluorethyl oder C_1 - C_4 -Alkoxy wie Methoxy, Isopropoxy und tert.-Butoxy;

- Phenyl, das eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann:

- Halogen wie Fluor, Chlor, Brom und Jod, insbesondere Fluor und Chlor, Nitro, Cyano, C_1 - C_4 -Alkyl wie Methyl, Ethyl und tert.-Butyl, partiell oder vollständig halogeniertes C_1 - C_4 -Alkyl wie Trifluormethyl, 1,1,2,2-Tetrafluorethyl und Trichlormethyl, C_1 - C_4 -Alkoxy wie Methoxy, Ethoxy und Isopropoxy, partiell oder voll-
30 ständig halogeniertes C_1 - C_4 -Alkoxy wie Trifluormethoxy, Chlordifluormethoxy, 1-Fluorethoxy, Pentafluorethoxy und 2-Chlor-1,1,2-trifluorethoxy oder C_1 - C_4 -Alkoxycarbonyl wie Methoxycarbonyl, n-Propoxycarbonyl und tert.-Butoxycarbonyl;

- einen 5- oder 6-gliedrigen gesättigten heterocyclischen Rest oder einen 5- oder 6-gliedrigen heteroaromatischen Rest mit jeweils 1 bis 3 Heteroatomen, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel und

35 Stickstoff, wobei zwei Sauerstoff- oder Schwefelatome oder ein Sauerstoff- und ein Schwefelatom nicht direkt benachbart sein können, wie vorstehend genannt, insbesondere 2-Tetrahydrofuranlyl, 3-Tetrahydrothienyl, 4-Tetrahydropyranlyl, 2-Furanlyl, 2-Thienyl, 4-Isoxazolyl, 5-Isotiazolyl, 2-Oxazolyl, 4-Thiazolyl, 2-Imidazolyl, 2-Pyrrolyl, 3-Pyrazolyl und 4-Pyridyl, wobei die Heterocyclen noch einen oder zwei der folgenden Substituenten tragen können: Halogen wie vorstehend genannt, C_1 - C_3 -Alkyl wie vorstehend genannt, C_1 - C_3 -Alkoxy wie vorstehend genannt und/oder C_1 - C_3 -Alkoxycarbonyl wie vorstehend genannt;

- einen Benzotriazolrest;

- N-Phthalimido, Tetrahydrophthalimido, N-Succinimido oder Maleinimido;

- die 2,2-Dimethyl-1,3-dioxolan-4-ylmethyl- oder die 1,3-Dioxolan-2-on-4-ylmethylgruppe;

- im Falle $Y = O$: ein Äquivalent eines Kations aus der Gruppe der Alkali- und Erdalkalimetalle wie Natrium, Kalium und Calcium, Mangan, Kupfer, Eisen, Ammonium und mit bis zu 4 C_1 - C_3 -Alkylgruppen substituiertes
45 Ammonium wie Tetramethylammonium;

- ein Rest $-N = CR^8R^9$ mit

R^8, R^9 - Wasserstoff;

- C_1 - C_4 -Alkyl oder partiell oder vollständig halogeniertes C_1 - C_4 -Alkyl wie Methyl, Ethyl, Isopropyl, tert.-Butyl, Chlormethyl, Fluormethyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl und 1,1,2,2-Tetrafluorethyl, wobei die Alkyl- oder Halogenalkylgruppe noch einen der folgenden Reste tragen kann:

- C_1 - C_3 -Alkoxy wie vorstehend genannt, insbesondere Methoxy,

- Phenyl, das zusätzlich ein- bis dreimal durch Nitro, Cyano, Halogen wie vorstehend genannt, insbesondere Fluor und Chlor, C_1 - C_3 -Alkyl wie vorstehend genannt, insbesondere Methyl und tert.-Butyl, partiell oder

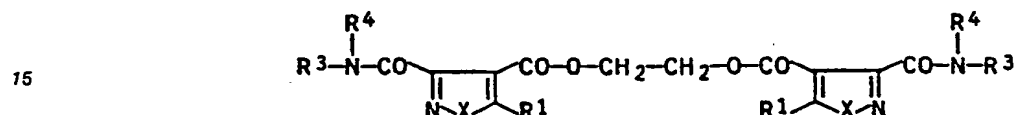
55 vollständig halogeniertes C_1 - C_3 -Alkyl wie vorstehend genannt, insbesondere Trifluormethyl, C_1 - C_3 -Alkoxy wie vorstehend genannt, insbesondere Methoxy und/oder partiell oder vollständig halogeniertes C_1 - C_3 -Alkoxy wie vorstehend genannt, insbesondere Trifluormethoxy, substituiert sein kann;

- C_3 - C_6 -Cycloalkyl wie Cyclopropyl, Cyclopentyl und Cyclohexyl;

- C₁-C₄-Alkoxy wie vorstehend genannt, insbesondere Methoxy;
- Furanyl oder Phenyl, das zusätzlich ein- bis dreimal durch Nitro, Cyano, Halogen wie vorstehend genannt, insbesondere Fluor und Chlor, C₁-C₃-Alkyl wie vorstehend genannt, insbesondere Methyl und tert.-Butyl, partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₃-Alkyl wie vorstehend genannt, insbesondere Trifluormethyl, C₁-C₃-Alkoxy wie vorstehend genannt, insbesondere Methoxy und/oder partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₃-Alkoxy wie vorstehend genannt, insbesondere Trifluormethoxy, substituiert sein kann;
- R⁸ und R⁹ - gemeinsam eine Methylenkette mit 4-7, bevorzugt 4-5 Gliedern;
- ein Rest -W-Z mit

W Ethylen-, n-Propylen- oder n-Butylenkette, Ethoxyethylenkette, But-2-enylen- oder But-2-inylenkette;

- 10 Z einen in ω-Stellung an W gebundenen Molekülteil, der den gleichen Molekülteil darstellt, der in α-Stellung von W mit W verknüpft ist, beispielsweise



R⁵ - Wasserstoff;

- 20 - C₁-C₆-Alkyl, bevorzugt C₁-C₄-Alkyl wie Methyl, Ethyl, Isopropyl und tert.-Butyl;
 - C₃-C₈-Cycloalkyl, bevorzugt C₃-C₆-Cycloalkyl wie Cyclopropyl, Cyclopentyl und Cyclohexyl;

R⁷ - Wasserstoff;

- C₁-C₆-Alkyl, bevorzugt C₁-C₄-Alkyl wie Methyl und tert.-Butyl;
 - ein Rest -C(OR¹²)=N-H oder -C(OR¹²)=N-(C₁-C₄)-alkyl, wobei C₁-C₄-alkyl eine Alkylgruppe wie vorstehend genannt, insbesondere Methyl, Ethyl und tert.-Butyl und R¹² ebenfalls eine C₁-C₄-Alkylgruppe wie vorstehend genannt, insbesondere Methyl, bedeutet;

R⁶, R⁷ - gemeinsam eine Methylenkette mit 4 bis 7, bevorzugt 4 bis 5 Gliedern;

R³ - Wasserstoff

- 30 - C₁-C₆-Alkyl, bevorzugt C₁-C₄-Alkyl wie Methyl, Ethyl und tert.-Butyl, das einen bis drei der folgenden Substituenten tragen kann: Hydroxy, Halogen, C₁-C₄-Alkoxy wie Methoxy und tert.-Butoxy, C₁-C₄-Alkylthio wie Methylthio und tert.-Butylthio oder Di-(C₁-C₄)-alkylamino, bevorzugt Di-(C₁-C₂)-alkylamino wie Dimethylamino und Diethylamino;

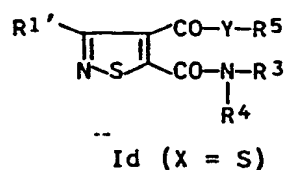
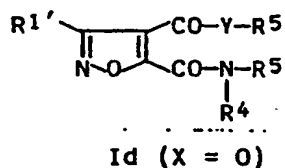
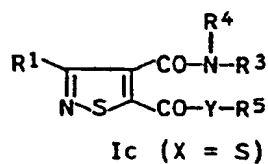
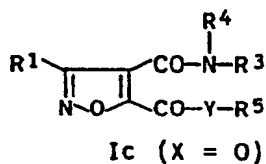
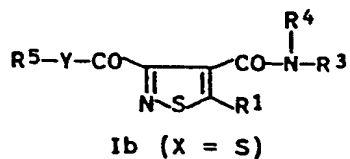
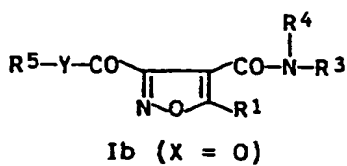
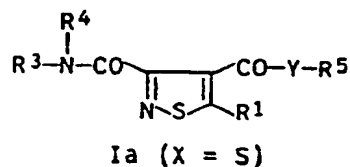
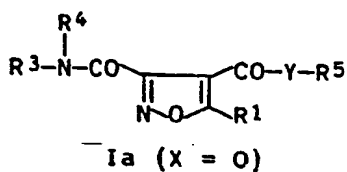
- 35 - C₃-C₈-Cycloalkyl, bevorzugt C₃-C₆-Cycloalkyl wie Cyclopropyl, Cyclopentyl und Cyclohexyl, das ein- bis dreimal durch Halogen wie Fluor, Chlor und Brom, C₁-C₄-Alkyl wie Methyl und tert.-Butyl oder partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₄-Alkyl wie Fluormethyl, Trifluormethyl, Chlordifluormethyl, Pentafluorethyl und 2-Chlor-1,1,2-trifluorethyl substituiert sein kann;

R⁴ - Wasserstoff, Hydroxyl;

- 40 - C₁-C₄-Alkoxy wie Methoxy, Ethoxy und tert.-Butoxy;
 - verzweigtes oder unverzweigtes C₁-C₆-Alkyl, bevorzugt C₁-C₄-Alkyl wie Methyl, Ethyl, Isopropyl und tert.-Butyl, welches ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: Halogen wie Fluor, Chlor und Brom, Cyano, C₁-C₄-Alkoxy wie Methoxy und tert.-Butoxy, partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₄-Alkoxy wie Fluormethoxy, Trichlormethoxy, 2-Chlor-1,1,2-trifluorethoxy und Pentafluorethoxy, C₁-C₄-Alkylthio wie Methylthio und tert.-Butylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio wie Fluormethylthio, Trichlormethylthio, 2-Chlor-1,1,2-trifluorethylthio und Pentafluorethylthio, Di-(C₁-C₄)-alkylamino, insbesondere C₃-C₆-Cycloalkyl wie Cyclopropyl, Cyclopentyl und Cyclohexyl oder Phenyl, wobei der Phenylrest seinerseits bis zu drei der folgenden Gruppen tragen kann: Halogen wie Fluor, Chlor und Brom, Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkyl wie Methyl und tert.-Butyl, C₁-C₄-Halogenalkyl wie Fluormethyl, Trichlormethyl, 2-Chlor-1,1,2-trifluor ethyl und Pentafluorethyl, C₁-C₄-Alkoxy wie Methoxy und tert.-Butoxy, partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₄-Alkoxy wie Fluormethoxy, Trichlormethoxy, 2-Chlor-1,1,2-trifluorethoxy und Pentafluorethoxy, C₁-C₄-Alkylthio wie Methylthio und tert.-Butylthio oder C₁-C₄-Halogenalkylthio wie Fluormethylthio, Trichlormethylthio, 2-Chlor-1,1,2-trifluorethylthio und Pentafluorethylthio;

- 45 - C₃-C₈-Cycloalkyl, bevorzugt C₃-C₆-Cycloalkyl, insbesondere Cyclopropyl, Cyclopentyl und Cyclohexyl, das jeweils einen bis drei der folgenden Reste tragen kann: Halogen wie Fluor, Chlor und Brom, Nitro, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, bevorzugt C₁-C₄-Alkyl wie Methyl und tert.-Butyl, partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₆-Alkyl, bevorzugt C₁-C₄-Halogenalkyl wie Fluormethyl, Trichlormethyl, 2-Chlor-1,1,2-trifluorethyl und Pentafluorethyl, C₁-C₄-Alkoxy wie Methoxy und tert.-Butoxy, oder partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₄-Alkoxy wie Fluormethoxy, Trichlormethoxy, 2-Chlor-1,1,2-trifluorethoxy und Pentafluorethoxy;

- C₃-C₆-Alkenyl oder C₃-C₆-Alkynyl, bevorzugt C₃-C₄-Alkenyl oder C₃-C₄-Alkynyl wie 2-Propenyl, 2-Butenyl, 2-Propinyl, 1,1-Dimethyl-2-propinyl und 3-Butinyl, welches jeweils bis zu dreifach durch Halogen wie Fluor, Chlor oder Brom und/oder einmal durch Phenyl substituiert sein kann, wobei der Phenylrest seinerseits eine bis drei der folgenden Substituenten tragen kann: Halogen, insbesondere Fluor und Chlor, Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkyl wie Methyl und tert.-Butyl, partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₄-Alkyl wie Fluormethyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, 2-Chlor-1,1,2-trifluorethyl und Pentafluorethyl, C₁-C₄-Alkoxy wie Methoxy und tert.-Butoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy wie Fluormethoxy, Trifluormethoxy, Trichlormethoxy, 2-Chlor-1,1,2-trifluorethoxy und Pentafluorethoxy, C₁-C₄-Alkylthio wie Methylthio und tert.-Butylthio, partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₄-Alkylthio wie Fluormethylthio, Trifluormethylthio, Trichlormethylthio, 2-Chlor-1,1,2-trifluorethylthio und Pentafluorethylthio;
 - Di(C₁-C₄)-alkylamino, bevorzugt Di-(C₁-C₂)-alkylamino wie Dimethylamino und Diethylamino;
 - ein 5- bis 6-gliedriger gesättigter oder aromatischer heterocyclischer Rest, enthaltend ein oder zwei Heteroatome, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff wie 2-Tetrahydrofuran, 3-Tetrahydrofuran, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Tetrahydrothienyl, 2-Tetrahydropyran, 3-Tetrahydropyran, 4-Tetrahydropyran, 2-Furan, 3-Furan, 2-Thienyl, 3-Thienyl, 3-Isoxazol, 4-Isoxazol, 5-Isoxazol, 3-Isotiazol, 4-Isotiazol, 5-Isotiazol, 2-Oxazol, 4-Oxazol, 5-Oxazol, 2-Thiazol, 4-Thiazol, 5-Thiazol, 2-Imidazol, 4-Imidazol, 5-Imidazol, 2-Pyrrol, 3-Pyrrol, 3-Pyrazol, 4-Pyrazol, 5-Pyrazol, 2-Pyridyl, 3-Pyridyl und 4-Pyridyl, der einen bis drei der folgenden Substituenten tragen kann: C₁-C₄-Alkyl wie vorstehend genannt, insbesondere Methyl oder Halogen wie vorstehend genannt, insbesondere Fluor und Chlor;
 - Phenyl, welches eine bis vier der folgenden Gruppen tragen kann: C₁-C₄-Alkyl wie vorstehend genannt, insbesondere Methyl, Ethyl und 1-Methylethyl; partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₄-Alkyl wie vorstehend genannt, insbesondere Trifluormethyl und Chlordifluormethyl; C₁-C₄-Alkoxy wie vorstehend genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₄-Alkoxy wie vorstehend genannt, insbesondere Trifluormethoxy, Trichlormethoxy und Pentafluorethoxy; C₁-C₄-Alkylthio wie vorstehend genannt, insbesondere Methylthio und Ethylthio; partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₄-Alkylthio wie vorstehend genannt, insbesondere Difluormethylthio, Trifluormethylthio und Pentafluormethylthio, Halogen wie vorstehend genannt, insbesondere Fluor und Chlor, Cyano, Nitro, Formyl, C₁-C₄-Alkanoyl wie Acetyl, Propionyl, Butyryl, insbesondere Acetyl, partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₄-Alkanoyl wie Trifluoracetyl, Trichloracetyl, Pentafluorpropionyl, insbesondere Trifluoracetyl oder C₁-C₄-Alkoxycarbonyl wie Methoxycarbonyl und tert.-Butoxycarbonyl;
 - Naphthyl, das ein- bis dreimal durch C₁-C₄-Alkyl wie Methyl und tert.-Butyl, insbesondere Methyl und Ethyl, oder Halogen wie Fluor und Chlor substituiert sein kann;
 - R³ und R⁴ gemeinsam eine C₄-C₇-Methylenkette, welche durch Sauerstoff, Schwefel oder N-Methyl unterbrochen sein kann wie -(CH₂)₃-, -(CH₂)₄-, -(CH₂)₅-, -(CH₂)₆-, -CH₂-O-CH₂-, -CH₂-CH₂-O-CH₂-CH₂-, -CH₂-S-CH₂-, -CH₂-CH₂-S-CH₂-CH₂-, -CH₂-CH₂-N(CH₃)-CH₂-CH₂-, insbesondere -(CH₂)₅- und -CH₂-CH₂-O-CH₂-CH₂-;
 - oder den Rest der Formel -(CH₂)₃-CO-.
- Bevorzugt werden Verbindungen der Formeln Ia bis Id, wobei R² einen Rest CO-Y-R⁵ und Y Sauerstoff oder Schwefel bedeutet:



In Tabelle 1 sind beispielhaft mögliche Substituenten R^1 , R^3 , R^4 und R^5 der bevorzugten Verbindungen Ia-Ic ($\text{R}^2 = \text{CO}-\text{Y}-\text{R}^5$), in Tabelle 2 mögliche Substituenten der Verbindungen Id ($\text{R}^2 = \text{CO}-\text{Y}-\text{R}^5$), aufgeführt, wobei die Carbonsäureamide Ia ($\text{R}^2 = \text{CO}-\text{Y}-\text{R}^5$) besonders bevorzugt sind.

Tabelle 1

| | R1 | R3 | R4 | R5 | Y |
|----|-----------------------|----|-------------|----|---|
| 5 | H | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| | F | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| | Cl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| | Methyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| 10 | Ethyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| | n-Propyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| | iso-Propyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| | n-Butyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| | iso-Butyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| 15 | sek.-Butyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| | tert.-Butyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| | cyclo-Propyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| | cyclo-Butyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| 20 | cyclo-Pentyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| | cyclo-Hexyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| | cyclo-Heptyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| | cyclo-Octyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| 25 | 1-Methylcyclopropyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| | Chlormethyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| | 1-Chlorethyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| | Trifluormethyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| 30 | Chlordifluormethyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| | Pentafluorethyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| | Methoxymethyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| | 1-Methylmethoxymethyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| 35 | 1-Methylmethoxyethyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| | Ethoxymethyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| | Vinyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| | Allyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| 40 | Methallyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| | Crotyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| | Ethynyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| | Propargyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| 45 | Phenylethynyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| | Methoxy | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| | Ethoxy | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| | Trifluormethoxy | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| 50 | Methylthio | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| | Trifluormethylthio | H | tert.-Butyl | H | 0 |

55

| | R1 | R3 | R4 | R5 | Y |
|----|---|----|--------------|----|---|
| | Phenoxy | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| | 4-Cl-Phenoxy | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| 5 | 2,4-(Cl,Cl)-Phenoxy | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| | 4-CF ₃ -Phenoxy | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| | Phenyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| | 2-F-Phenylthio | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| 10 | 3-F-Phenyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| | 2,4-(F,F)-Phenyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| | 2-Cl-Phenyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| | 3-Cl-Phenyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| | 2,4-(Cl,Cl)-Phenyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| 15 | 2-CH ₃ -Phenyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| | 3-CH ₃ -Phenyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| | 4-CH ₃ -Phenyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| | 2,4-(CH ₃ ,CH ₃)-Phenyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| 20 | 2,4,6-(CH ₃ ,CH ₃ ,CH ₃)-Phenyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| | 2-CF ₃ -Phenyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| | 2-OCH ₃ -Phenyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| | 2,4-(OCH ₃ ,OCH ₃)-Phenyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| 25 | 4-OCF ₃ -Phenyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| | 4-SCH ₃ -Phenyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| | 3-SCF ₃ -Phenyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| | 2,4-(NO ₂ ,NO ₂)-Phenyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| 30 | 4-NO ₂ -Phenyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| | 2-Thienyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| | 3-Thienyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| | 2-Furanyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| 35 | 3-Furanyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| | 2-Tetrahydrofuranyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| | 3-Tetrahydrofuranyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| | 2-Pyridyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| 40 | 3-Pyridyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| | 4-Pyridyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| | 2-Tetrahydropyranyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| | 3-Tetrahydropyranyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| 45 | 4-Tetrahydropyranyl | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| | iso-Propoxy | H | tert.-Butyl | H | 0 |
| | H | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | F | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| 50 | Cl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | Methyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | Ethyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |

| | R1 | R3 | R4 | R5 | Y |
|----|----------------------------|----|--------------|----|---|
| | n-Propyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | iso-Propyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| 5 | n-Butyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | iso-Butyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | sek.-Butyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | tert.-Butyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| 10 | cyclo-Propyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | cyclo-Butyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | cyclo-Pentyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | cyclo-Hexyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| 15 | cyclo-Heptyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | cyclo-Octyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | 1-Methylcyclopropyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | Chlormethyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| 20 | 1-Chlorethyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | Trifluormethyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | Chlordifluormethyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | Pentafluorethyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| 25 | Methoxymethyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | 1-Methylmethoxymethyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | 1-Methylmethoxyethyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | Ethoxymethyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| 30 | Vinyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | Allyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | Methallyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | Crotyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | Ethynyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| 35 | Propargyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | Phenylethynyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | Methoxy | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | Ethoxy | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| 40 | Trifluormethoxy | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | Methylthio | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | Trifluormethylthio | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | Phenoxy | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| 45 | 4-Cl-Phenoxy | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | 2,4-(Cl, Cl)-Phenoxy | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | 4-CF ₃ -Phenoxy | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | Phenyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| 50 | 2-F-Phenylthio | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | 3-F-Phenyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | 2,4-(F, F)-Phenyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |

| | R1 | R3 | R4 | R5 | Y |
|----|---|--------|--------------|----|---|
| | 2-Cl-Phenyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| 5 | 3-Cl-Phenyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | 2,4-(Cl, Cl)-Phenyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | 2-CH ₃ -Phenyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | 3-CH ₃ -Phenyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| 10 | 4-CH ₃ -Phenyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | 2,4-(CH ₃ , CH ₃)-Phenyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | 2,4,6-(CH ₃ , CH ₃ , CH ₃)-Phenyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | 2-CF ₃ -Phenyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| 15 | 2-OCH ₃ -Phenyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | 2,4-(OCH ₃ , OCH ₃)-Phenyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | 4-OCF ₃ -Phenyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | 4-SCH ₃ -Phenyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| 20 | 3-SCF ₃ -Phenyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | 2,4-(NO ₂ , NO ₂)-Phenyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | 4-NO ₂ -Phenyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | 2-Thienyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| 25 | 3-Thienyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | 2-Furanyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | 3-Furanyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | 2-Tetrahydrofuranyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| 30 | 3-Tetrahydrofuranyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | 2-Pyridyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | 3-Pyridyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | 4-Pyridyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | 2-Tetrahydropyranyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| 35 | 3-Tetrahydropyranyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | 4-Tetrahydropyranyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | iso-Propoxy | H | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | H | Methyl | tert.-Butyl | H | 0 |
| 40 | F | Methyl | tert.-Butyl | H | 0 |
| | Cl | Methyl | tert.-Butyl | H | 0 |
| | Methyl | Methyl | tert.-Butyl | H | 0 |
| | Ethyl | Methyl | tert.-Butyl | H | 0 |
| 45 | n-Propyl | Methyl | tert.-Butyl | H | 0 |
| | iso-Propyl | Methyl | tert.-Butyl | H | 0 |
| | n-Butyl | Methyl | tert.-Butyl | H | 0 |
| | iso-Butyl | Methyl | tert.-Butyl | H | 0 |
| 50 | sek.-Butyl | Methyl | tert.-Butyl | H | 0 |
| | tert.-Butyl | Methyl | tert.-Butyl | H | 0 |
| | cyclo-Propyl | Methyl | tert.-Butyl | H | 0 |
| | cyclo-Butyl | Methyl | tert.-Butyl | H | 0 |
| 55 | cyclo-Pentyl | Methyl | tert.-Butyl | H | 0 |

| | R1 | R3 | R4 | R5 | Y |
|----|-----------------------|------------|--------------|----|---|
| | cyclo-Hexyl | iso-Propyl | tert.-Butyl | H | 0 |
| 5 | cyclo-Heptyl | iso-Propyl | tert.-Butyl | H | 0 |
| | cyclo-Octyl | iso-Propyl | tert.-Butyl | H | 0 |
| | 1-Methylcyclopropyl | iso-Propyl | tert.-Butyl | H | 0 |
| | Trifluormethyl | iso-Propyl | tert.-Butyl | H | 0 |
| 10 | Chlordifluormethyl | iso-Propyl | tert.-Butyl | H | 0 |
| | Pentafluorethyl | iso-Propyl | tert.-Butyl | H | 0 |
| | Methoxymethyl | iso-Propyl | tert.-Butyl | H | 0 |
| | 1-Methylmethoxymethyl | iso-Propyl | tert.-Butyl | H | 0 |
| 15 | 1-Methylmethoxyethyl | iso-Propyl | tert.-Butyl | H | 0 |
| | Ethoxymethyl | iso-Propyl | tert.-Butyl | H | 0 |
| | Vinyl | iso-Propyl | tert.-Butyl | H | 0 |
| | Allyl | iso-Propyl | tert.-Butyl | H | 0 |
| 20 | Methallyl | iso-Propyl | tert.-Butyl | H | 0 |
| | Crotyl | iso-Propyl | tert.-Butyl | H | 0 |
| | Ethynyl | iso-Propyl | tert.-Butyl | H | 0 |
| | Propargyl | iso-Propyl | tert.-Butyl | H | 0 |
| 25 | Phenylethynyl | iso-Propyl | tert.-Butyl | H | 0 |
| | Methoxy | iso-Propyl | tert.-Butyl | H | 0 |
| | Ethoxy | iso-Propyl | tert.-Butyl | H | 0 |
| | Trifluormethoxy | iso-Propyl | tert.-Butyl | H | 0 |
| 30 | H | Methyl | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | F | Methyl | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | Cl | Methyl | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | Methyl | Methyl | cyclo-Propyl | H | 0 |
| 35 | Ethyl | Methyl | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | n-Propyl | Methyl | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | iso-Propyl | Methyl | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | n-Butyl | iso-Propyl | cyclo-Propyl | H | 0 |
| 40 | iso-Butyl | iso-Propyl | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | sek.-Butyl | iso-Propyl | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | tert.-Butyl | iso-Propyl | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | cyclo-Propyl | iso-Propyl | cyclo-Propyl | H | 0 |
| 45 | cyclo-Butyl | iso-Propyl | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | cyclo-Pentyl | iso-Propyl | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | cyclo-Hexyl | Methyl | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | cyclo-Heptyl | Methyl | cyclo-Propyl | H | 0 |
| 50 | cyclo-Octyl | Methyl | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | 1-Methylcyclopropyl | Methyl | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | Trifluormethyl | Methyl | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | Chlordifluormethyl | Methyl | cyclo-Propyl | H | 0 |
| 55 | Pentafluorethyl | Methyl | cyclo-Propyl | H | 0 |

| | R ¹ | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | Y |
|----|-----------------------|----------------|----------------|----------------|---|
| | Methoxymethyl | iso-Propyl | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | 1-Methylmethoxymethyl | iso-Propyl | cyclo-Propyl | H | 0 |
| 5 | 1-Methylmethoxyethyl | iso-Propyl | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | Ethoxymethyl | iso-Propyl | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | Vinyl | iso-Propyl | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | Allyl | iso-Propyl | cyclo-Propyl | H | 0 |
| 10 | Methallyl | iso-Propyl | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | Crotyl | Methyl | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | Ethynyl | Methyl | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | Propargyl | Methyl | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | Phenylethynyl | Methyl | cyclo-Propyl | H | 0 |
| 15 | Methoxy | Methyl | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | Ethoxy | Methyl | cyclo-Propyl | H | 0 |
| | Trifluormethoxy | Methyl | cyclo-Propyl | H | 0 |

20

25

30

35

40


45





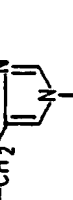
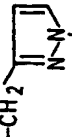
50

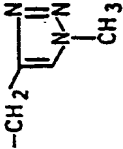

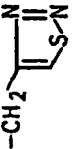

55

Tabelle 1 (Fortsetzung)

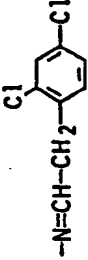
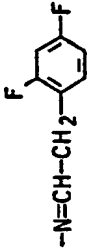

| R1 | R3 | R4 | R5 | Y |
|--------|----|-------------|---|---|
| Chlor | H | tert.-Butyl | 4-Hydroxy-2-butyl | 0 |
| Chlor | H | tert.-Butyl | N=C(C ₂ H ₅) ₂ | 0 |
| Chlor | H | tert.-Butyl | N=C(cyclo-C ₃ H ₅) ₂ | 0 |
| Chlor | H | tert.-Butyl | 2-Butanimino | 0 |
| Chlor | H | tert.-Butyl | Cyclohexanimino | 0 |
| Chlor | H | tert.-Butyl | Cyclooctanimino | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | N=CH-C ₆ H ₅ | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | 2-Furyl-methanimino | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂ | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | CH ₂ CH ₂ N ⁺ (CH ₃) ₃ I ⁻ | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | CH ₂ CF ₃ | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | CH ₂ CH ₂ Cl | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | CH ₂ CH ₂ CN | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | Methyl | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | Ethyl | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | n-Propyl | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | iso-Propyl | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | tert.-Butyl | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | n-Butyl | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | CH ₂ -CCl ₃ | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | CH ₂ -CH(OCH ₃) ₂ | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | CH ₂ -C(OCH ₃) ₃ | 0 |

| R ¹ | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | Y |
|----------------|----------------|----------------|--|---|
| Methyl | H | tert.-Butyl | CH ₂ -CH(OH)-CH ₂ -OH | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -OH | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₃ | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | CH ₂ -CH ₂ -S-CH ₃ | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | CH ₂ -CH ₂ -NHCH ₃ | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | CH ₂ -CH ₂ -NH(cyclopropyl) | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | CH ₂ -CH ₂ -N(cyclopropyl) ₂ | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | CH ₂ -CH ₂ -Si(CH ₃) ₃ | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | CH ₂ -CH ₂ -SOCH ₃ | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | CH ₂ -CH ₂ -SO ₂ CH ₃ | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | CH ₂ -CO ₂ H | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | CH ₂ -CO ₂ CH ₃ | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -CO ₂ CH ₃ | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | CH ₂ -CH ₂ -CO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -CO ₂ CH ₃ | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | CH ₂ -CON(CH ₃) ₂ | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | CH ₂ -PO(OC ₂ H ₅) ₂ | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | CH ₂ -CH ₂ -O-N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | CH ₂ -CH ₂ -O-N=  | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | N-Phthalimidomethyl | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | N-Succinimidomethyl | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | Benzoyloxymethyl | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | (4-Br-benzoyl)-methyl | 0 |

| R ¹ | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | Y |
|----------------|----------------|----------------|---|---|
| Methyl | H | tert.-Butyl | (4-Methoxybenzoyl)methyl | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | 2-Tetrahydrofuran-1-ylmethyl | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | 2-Tetrahydrothien-1-ylmethyl | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | 4-Tetrahydropyran-1-ylmethyl | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | 2-Furan-1-ylmethyl | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | 2-Thien-1-ylmethyl | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl |  | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl |  | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl |  | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl |  | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl |  | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | N-Methylpyrrolidin-3-ylmethyl | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | N-Methylpyrrol-3-ylmethyl | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl |  | 0 |

| R1 | R3 | R4 | R5 | Y |
|--------|----|-------------|---|---|
| Methyl | H | tert.-Butyl |  | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | 2-Pyridyl-methyl | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | 3-Pyridyl-methyl | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | 4-Pyridyl-methyl | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl |  | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl |  | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl |  | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | Benzyl | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | 2,4-Dichlorobenzyl | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | 2-Phenylethyl | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | Cyclopentyl | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | Cyclohexyl | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | 2-Propenyl | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | $\text{CH}_2=\text{CH}-\text{C}_6\text{H}_5$ | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | 2-Cyclohexenyl | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | 2-Propinyl | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | $\text{CH}_2-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{OH}$ | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | 4-F-Phenyl | 0 |

| R1 | R3 | R4 | R5 | Y |
|--------|----|-------------|--|---|
| Methyl | H | tert.-Butyl | 4-NO ₂ -Phenyl | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | 4-CN-Phenyl | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | 4-CH ₃ -Phenyl | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | 4-CF ₃ -Phenyl | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | 3, 5-(CF ₃ , CF ₃)-Phenyl | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | 2-NO ₂ -4-F-Phenyl | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | 4-OCH ₃ -Phenyl | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | 4-OCF ₃ -Phenyl | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | 4-CO ₂ CH ₃ -Phenyl | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | 2, 6(Br, Br)-4-NO ₂ -Phenyl | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | 2-Tetrahydrofuran-2-yl | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | 2-Tetrahydropyran-2-yl | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | 1-Pyrazol-1-yl | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | 1-(1, 2, 3)-Triazol-1-yl | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | 1-Benzotriazol-1-yl | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | Phthalimido | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | Tetrahydrophthalimido | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | Succinimido | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | Maleiminido | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | Na ⁺ | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | K ⁺ | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | NH ₄ ⁺ | 0 |

| R ¹ | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | Y |
|----------------|----------------|----------------|---|---|
| Methyl | H | tert.-Butyl | [⊕] NH ₃ -(iso-Propyl) | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | [⊕] NH ₂ -(iso-Propyl) ₂ | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | 2-Propanimino | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | 2-Butanimino | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | -N=C(C ₂ H ₅) ₂ | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl |  | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl |  | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | -N=C(cyclopropyl) ₂ | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | Cyclopentanimino | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | Cyclohexanimino | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | CH ₂ -CH=N-OCH ₃ | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | CH ₂ -CH=N-OC ₂ H ₅ | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | CH ₂ -CH=N-O-CH ₂ -C=CH ₂ | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | CH ₂ -CH=N-O-CH ₂ -C≡CH | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | CH ₂ -CH=N-O-CH ₂ -CH=CH-  | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | CH ₂ -CH=N-N-CH ₃ | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | CH ₂ -CH=N-N-C ₆ H ₅ | 0 |
| iso-Propyl | H | tert.-Butyl | CH ₂ CCl ₃ | 0 |

| 55 | 40 | 35 | 30 | 25 | 20 | 15 | 10 | 5 |
|--------------|----|-------------|----|--|----|----|----|---|
| R1 | R3 | R4 | | R5 | | | | Y |
| Iso-Propyl | H | tert.-Butyl | | CH ₂ CH ₂ Si(CH ₃) ₃ | | | | 0 |
| Iso-Propyl | H | tert.-Butyl | | CH ₂ CH ₂ O-N=C(CH ₃) ₂ | | | | 0 |
| Iso-Propyl | H | tert.-Butyl | | CH ₂ PO(OC ₂ H ₅) ₂ | | | | 0 |
| Iso-Propyl | H | tert.-Butyl | | CH(CH ₃)CH(OC ₂ H ₅) ₂ | | | | 0 |
| Iso-Propyl | H | tert.-Butyl | | CH ₂ -CON(C ₂ H ₅) ₂ | | | | 0 |
| Iso-Propyl | H | tert.-Butyl | | Benzyl | | | | 0 |
| cyclo-Propyl | H | tert.-Butyl | | 2,4-(Cl,Cl)-Benzyl | | | | 0 |
| cyclo-Propyl | H | tert.-Butyl | | 3-Pyridyl-methyl | | | | 0 |
| cyclo-Propyl | H | tert.-Butyl | | 2-Thienyl-methyl | | | | 0 |
| cyclo-Propyl | H | tert.-Butyl | | 2-Tetrahydrofuryl-methyl | | | | 0 |
| cyclo-Propyl | H | tert.-Butyl | | 2-Furyl-methyl | | | | 0 |
| cyclo-Propyl | H | tert.-Butyl | | 2-Pyridyl-methyl | | | | 0 |
| cyclo-Propyl | H | tert.-Butyl | | Phenyl | | | | 0 |
| Allyl | H | tert.-Butyl | | 4-F-Phenyl | | | | 0 |
| Allyl | H | tert.-Butyl | | 4-Trifluoromethylphenyl | | | | 0 |
| Allyl | H | tert.-Butyl | | 2-NO ₂ -4-F-Phenyl | | | | 0 |
| Allyl | H | tert.-Butyl | | 3,5-(CF ₃ ,CF ₃)-Phenyl | | | | 0 |
| Allyl | H | tert.-Butyl | | 4-OCH ₃ -Phenyl | | | | 0 |
| Allyl | H | tert.-Butyl | | 4-OCF ₃ -Phenyl | | | | 0 |
| Allyl | H | tert.-Butyl | | 4-NHCOCH ₃ -Phenyl | | | | 0 |
| Ethynyl | H | tert.-Butyl | | 2-Tetrahydropyranyl | | | | 0 |
| Ethynyl | H | tert.-Butyl | | 2-Tetrahydrofuryl | | | | 0 |
| Ethynyl | H | tert.-Butyl | | 1-Benzotriazolyl | | | | 0 |

| 55 | 50 | 45 | 40 | 35 | 30 | 25 | 20 | 15 | 10 | 5 | Y |
|--------------|----|-------------|--|----|----|----|----|----|----|---|---|
| R1 | R3 | R4 | R5 | | | | | | | | |
| Ethiny1 | H | tert.-Butyl | Methyl | | | | | | | | 0 |
| Ethiny1 | H | tert.-Butyl | Ethyl | | | | | | | | 0 |
| Ethiny1 | H | tert.-Butyl | n-Propyl | | | | | | | | 0 |
| Ethiny1 | H | tert.-Butyl | iso-Propyl | | | | | | | | 0 |
| Methoxy | H | tert.-Butyl | n-Butyl | | | | | | | | 0 |
| Methoxy | H | tert.-Butyl | iso-Butyl | | | | | | | | 0 |
| Methoxy | H | tert.-Butyl | sek.-Butyl | | | | | | | | 0 |
| Methoxy | H | tert.-Butyl | tert.-Butyl | | | | | | | | 0 |
| Methoxy | H | tert.-Butyl | cyclo-Hexyl | | | | | | | | 0 |
| Methoxy | H | tert.-Butyl | Cyclopropylmethyl | | | | | | | | 0 |
| Methoxy | H | tert.-Butyl | Ethoxymethyl | | | | | | | | 0 |
| 4-Cl-Phenoxy | H | tert.-Butyl | 2-Methoxy-ethoxy-methyl | | | | | | | | 0 |
| 4-Cl-Phenoxy | H | tert.-Butyl | Benzoyloxymethyl | | | | | | | | 0 |
| 4-Cl-Phenoxy | H | tert.-Butyl | (4-Brombenzoyl)-methyl | | | | | | | | 0 |
| 4-Cl-Phenoxy | H | tert.-Butyl | (4-Methoxybenzoyl)-methyl | | | | | | | | 0 |
| 4-Cl-Phenoxy | H | tert.-Butyl | Phthalimidomethyl | | | | | | | | 0 |
| 4-Cl-Phenoxy | H | tert.-Butyl | Methylthiomethyl | | | | | | | | 0 |
| 4-Cl-Phenoxy | H | tert.-Butyl | 2-Thiomethyl-ethyl | | | | | | | | 0 |
| Phenylthio | H | tert.-Butyl | CH(C ₆ H ₅)COOCH ₃ | | | | | | | | 0 |
| Phenylthio | H | tert.-Butyl | Phenylethyl | | | | | | | | 0 |
| Phenylthio | H | tert.-Butyl | 4-F-Phenylethyl | | | | | | | | 0 |
| Phenylthio | H | tert.-Butyl | Phthalimido | | | | | | | | 0 |
| Phenylthio | H | tert.-Butyl | Tetrahydrophthalimido | | | | | | | | 0 |

| R1 | R3 | R4 | R5 | Y |
|---------------------|----|--------------|--|---|
| Phenylthio | H | tert.-Butyl | Maleinimido | 0 |
| Phenylthio | H | tert.-Butyl | Succinimido | 0 |
| 2,4-(Cl, Cl)-Phenyl | H | tert.-Butyl | Piperidino | 0 |
| 2,4-(Cl, Cl)-Phenyl | H | tert.-Butyl | Li ⁺ | 0 |
| 2,4-(Cl, Cl)-Phenyl | H | tert.-Butyl | Na ⁺ | 0 |
| 2,4-(Cl, Cl)-Phenyl | H | tert.-Butyl | K ⁺ | 0 |
| 2,4-(Cl, Cl)-Phenyl | H | tert.-Butyl | NH ₄ ⁺ | 0 |
| 2,4-(Cl, Cl)-Phenyl | H | tert.-Butyl | Diisopropylammonium | 0 |
| 2,4-(Cl, Cl)-Phenyl | H | tert.-Butyl | 2-Hydroxyethyl-ammonium | 0 |
| 2-Thienyl | H | tert.-Butyl | Allyl | 0 |
| 2-Thienyl | H | tert.-Butyl | Methallyl | 0 |
| 2-Thienyl | H | tert.-Butyl | 2-Chlorallyl | 0 |
| 2-Thienyl | H | tert.-Butyl | Propargyl | 0 |
| 2-Thienyl | H | tert.-Butyl | 3-Jodpropargyl | 0 |
| Chlor | H | cyclo-Propyl | 4-Hydroxy-2-butynyl | 0 |
| Chlor | H | cyclo-Propyl | N=C(C ₂ H ₅) ₂ | 0 |
| Chlor | H | cyclo-Propyl | N=C(cyclo-C ₃ H ₅) ₂ | 0 |
| Chlor | H | cyclo-Propyl | 2-Butanimino | 0 |
| Chlor | H | cyclo-Propyl | Cyclohexanimino | 0 |
| Chlor | H | cyclo-Propyl | Cyclooctanimino | 0 |
| Methyl | H | cyclo-Propyl | N=CH-C ₆ H ₅ | 0 |
| Methyl | H | cyclo-Propyl | 2-Furyl-methanimino | 0 |
| Methyl | H | cyclo-Propyl | CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂ | 0 |

| | R1 | R3 | R4 | R5 | Y |
|----|--------------|----|--------------|---|---|
| 55 | Methyl | H | cyclo-Propyl | $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{N}^+(\text{CH}_3)_3\text{I}^-$ | 0 |
| | Methyl | H | cyclo-Propyl | CH_2CF_3 | 0 |
| | Methyl | H | cyclo-Propyl | $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$ | 0 |
| | Methyl | H | cyclo-Propyl | $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CN}$ | 0 |
| | iso-Propyl | H | cyclo-Propyl | CH_2CCl_3 | 0 |
| | iso-Propyl | H | cyclo-Propyl | $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Si}(\text{CH}_3)_3$ | 0 |
| | iso-Propyl | H | cyclo-Propyl | $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-\text{N}=\text{C}(\text{CH}_3)_2$ | 0 |
| | iso-Propyl | H | cyclo-Propyl | $\text{CH}_2\text{PO}(\text{OC}_2\text{H}_5)_2$ | 0 |
| | iso-Propyl | H | cyclo-Propyl | $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{OCH}_3)_2$ | 0 |
| | iso-Propyl | H | cyclo-Propyl | $\text{CH}_2-\text{CON}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$ | 0 |
| | iso-Propyl | H | cyclo-Propyl | Benzyl | 0 |
| | cyclo-Propyl | H | cyclo-Propyl | 2,4-(Cl, Cl)-Benzyl | 0 |
| | cyclo-Propyl | H | cyclo-Propyl | 3-Pyridyl-methyl | 0 |
| | cyclo-Propyl | H | cyclo-Propyl | 2-Thienyl-methyl | 0 |
| | cyclo-Propyl | H | cyclo-Propyl | 2-Tetrahydrofuran-1-methyl | 0 |
| | cyclo-Propyl | H | cyclo-Propyl | 2-Furanyl-methyl | 0 |
| | cyclo-Propyl | H | cyclo-Propyl | 2-Pyridyl-methyl | 0 |
| | cyclo-Propyl | H | cyclo-Propyl | Phenyl | 0 |
| | Allyl | H | cyclo-Propyl | 4-F-Phenyl | 0 |
| | Allyl | H | cyclo-Propyl | 4-Trifluoromethylphenyl | 0 |
| | Allyl | H | cyclo-Propyl | 2-NO ₂ -4-F-Phenyl | 0 |
| | Allyl | H | cyclo-Propyl | 3,5-(CF ₃ , CF ₃)-Phenyl | 0 |
| | Allyl | H | cyclo-Propyl | 4-OCH ₃ -Phenyl | 0 |

| R1 | R3 | R4 | R5 | Y |
|--------------|----|--------------|-------------------------------|---|
| Allyl | H | cyclo-Propyl | 4-OCF ₃ -Phenyl | 0 |
| Allyl | H | cyclo-Propyl | 4-NHCOCH ₃ -Phenyl | 0 |
| Ethynyl | H | cyclo-Propyl | 2-Tetrahydropranyl | 0 |
| Ethynyl | H | cyclo-Propyl | 2-Tetrahydrofuranyl | 0 |
| Ethynyl | H | cyclo-Propyl | 1-Benzotriazolyl | 0 |
| Ethynyl | H | cyclo-Propyl | Methyl | 0 |
| Ethynyl | H | cyclo-Propyl | Ethyl | 0 |
| Ethynyl | H | cyclo-Propyl | n-Propyl | 0 |
| Ethynyl | H | cyclo-Propyl | iso-Propyl | 0 |
| Methoxy | H | cyclo-Propyl | n-Butyl | 0 |
| Methoxy | H | cyclo-Propyl | iso-Butyl | 0 |
| Methoxy | H | cyclo-Propyl | sek.-Butyl | 0 |
| Methoxy | H | cyclo-Propyl | tert.-Butyl | 0 |
| Methoxy | H | cyclo-Propyl | cyclo-Hexyl | 0 |
| Methoxy | H | cyclo-Propyl | Cyclopropylmethyl | 0 |
| Methoxy | H | cyclo-Propyl | Ethoxymethyl | 0 |
| 4-Cl-Phenoxy | H | cyclo-Propyl | 2-Methoxy-ethoxy-methyl | 0 |
| 4-Cl-Phenoxy | H | cyclo-Propyl | Benzylloxymethyl | 0 |
| 4-Cl-Phenoxy | H | cyclo-Propyl | (4-Brombenzoyl)-methyl | 0 |
| 4-Cl-Phenoxy | H | cyclo-Propyl | (4-Methoxybenzoyl)-methyl | 0 |
| 4-Cl-Phenoxy | H | cyclo-Propyl | Phthalimidomethyl | 0 |
| 4-Cl-Phenoxy | H | cyclo-Propyl | Methylthiomethyl | 0 |
| 4-Cl-Phenoxy | H | cyclo-Propyl | 2-Thiomethyl-ethyl | 0 |

| R1 | R3 | R4 | R5 | Y |
|---------------------|----|--------------|--|---|
| Phenylthio | H | cyclo-Propyl | CH(C ₆ H ₅)COOCH ₃ | 0 |
| Phenylthio | H | cyclo-Propyl | Phenylethyl | 0 |
| Phenylthio | H | cyclo-Propyl | 4-F-Phenylethyl | 0 |
| Phenylthio | H | cyclo-Propyl | Phthalimido | 0 |
| Phenylthio | H | cyclo-Propyl | Tetrahydrophthalimido | 0 |
| Phenylthio | H | cyclo-Propyl | Maleinimido | 0 |
| Phenylthio | H | cyclo-Propyl | Succinimido | 0 |
| Phenylthio | H | cyclo-Propyl | Piperidino | 0 |
| 2,4-(Cl, Cl)-Phenyl | H | cyclo-Propyl | Li ⁺ | 0 |
| 2,4-(Cl, Cl)-Phenyl | H | cyclo-Propyl | Na ⁺ | 0 |
| 2,4-(Cl, Cl)-Phenyl | H | cyclo-Propyl | K ⁺ | 0 |
| 2,4-(Cl, Cl)-Phenyl | H | cyclo-Propyl | NH ₄ ⁺ | 0 |
| 2,4-(Cl, Cl)-Phenyl | H | cyclo-Propyl | Diisopropylammonium | 0 |
| 2,4-(Cl, Cl)-Phenyl | H | cyclo-Propyl | 2-Hydroxyethyl-ammonium | 0 |
| 2-Thienyl | H | cyclo-Propyl | Allyl | 0 |
| 2-Thienyl | H | cyclo-Propyl | Methallyl | 0 |
| 2-Thienyl | H | cyclo-Propyl | 2-Chlorallyl | 0 |
| 2-Thienyl | H | cyclo-Propyl | Propargyl | 0 |
| 2-Thienyl | H | cyclo-Propyl | 3-Iodopropargyl | 0 |
| H | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| F | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| Cl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |

| R1 | R3 | R4 | R5 | Y |
|-----------------------|----|-------------|-------------------------------------|---|
| Ethyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| n-Propyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| iso-Propyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| n-Butyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| iso-Butyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| sek.-Butyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| tert.-Butyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| cyclo-Propyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| cyclo-Butyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| cyclo-Pentyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| cyclo-Hexyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| cyclo-Heptyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| cyclo-Octyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 1-Methylcyclopropyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| Chlormethyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 1-Chlorethyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| Trifluormethyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| Chlordifluormethyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| Pentafluormethyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| iso-Propoxy | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| Methoxymethyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 1-Methylmethoxymethyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 1-Methylmethoxyethyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |

| R1 | R3 | R4 | R5 | Y |
|----------------------------|----|-------------|-------------------------------------|---|
| Ethoxymethyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| Vinyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| Allyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| Methallyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| Crotyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| Ethynyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| Propargyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| Phenylethynyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| Methoxy | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| Ethoxy | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| Trifluormethoxy | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| Methylthio | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| Trifluormethylthio | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| Phenoxy | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 4-Cl-Phenoxy | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 2,4-(Cl,Cl)-Phenoxy | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 4-CF ₃ -Phenoxy | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| Phenyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 2-F-Phenylthio | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 3-F-Phenyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 2,4-(F,F)-Phenyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 2-Cl-Phenyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 3-Cl-Phenyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |

| R1 | R3 | R4 | R5 | Y |
|---|----|-------------|-------------------------------------|---|
| 2,4-(Cl,Cl)-Phenyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 2-CH ₃ -Phenyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 3-CH ₃ -Phenyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 4-CH ₃ -Phenyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 2,4-(CH ₃ ,CH ₃)-Phenyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 2,4,6-(CH ₃ ,CH ₃ ,CH ₃)-Phenyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 2-CF ₃ -Phenyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 2-OCH ₃ -Phenyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 2,4-(OCH ₃ ,OCH ₃)-Phenyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 4-OCF ₃ -Phenyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 4-SCH ₃ -Phenyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 3-SCF ₃ -Phenyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 2,4-(NO ₂ ,NO ₂)-Phenyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 4-NO ₂ -Phenyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 2-Thienyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 3-Thienyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 2-Furanyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 3-Furanyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 2-Tetrahydrofuranyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 3-Tetrahydrofuranyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 2-Pyridyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 3-Pyridyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 4-Pyridyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |

| R1 | R3 | R4 | R5 | Y |
|---------------------|----|--------------|-------------------------------------|---|
| 2-Tetrahydropyranyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 3-Tetrahydropyranyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 4-Tetrahydropyranyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| H | H | cyclo-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| F | H | cyclo-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| Cl | H | cyclo-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| Methyl | H | cyclo-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| Ethyl | H | cyclo-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| n-Propyl | H | cyclo-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| iso-Propyl | H | cyclo-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| n-Butyl | H | cyclo-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| iso-Butyl | H | cyclo-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| sek.-Butyl | H | cyclo-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| tert.-Butyl | H | cyclo-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| cyclo-Propyl | H | cyclo-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| cyclo-Butyl | H | cyclo-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| cyclo-Pentyl | H | cyclo-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| cyclo-Hexyl | H | cyclo-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| cyclo-Heptyl | H | cyclo-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| cyclo-Octyl | H | cyclo-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 1-Methylcyclopropyl | H | cyclo-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| Chlormethyl | H | cyclo-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 1-Chlorethyl | H | cyclo-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |

| R1 | R3 | R4 | R5 | Y |
|-----------------------|----|--------------|-------------------------------------|---|
| Trifluormethyl | H | cyclo-propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| Chlorodifluormethyl | H | cyclo-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| Pentafluorethyl | H | cyclo-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| Iso-Propoxy | H | cyclo-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| Methoxymethyl | H | cyclo-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 1-Methylmethoxymethyl | H | cyclo-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 1-Methylmethoxyethyl | H | cyclo-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| Ethoxymethyl | H | cyclo-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| Vinyl | H | cyclo-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| Allyl | H | cyclo-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| Methallyl | H | cyclo-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| Crotyl | H | cyclo-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| Ethynyl | H | cyclo-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| Propargyl | H | cyclo-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| Phenylethynyl | H | cyclo-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| Methoxy | H | cyclo-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| Ethoxy | H | cyclo-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| Trifluormethoxy | H | cyclo-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| Methylthio | H | cyclo-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| Trifluormethylthio | H | cyclo-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| Phenoxy | H | cyclo-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 4-Cl-Phenoxy | H | cyclo-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 2,4-(Cl, Cl)-Phenoxy | H | cyclo-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |

| 55 | 50 | 45 | 40 | 35 | 30 | 25 | 20 | 16 | 10 | 5 | Y |
|---|----|----|----|--------------|----|----|-------------------------------------|----|----|---|---|
| R1 | | | R3 | R4 | | | R5 | | | | |
| 4-CF ₃ -Phenoxy | | | H | cyclo-Propyl | | | -N=C(CH ₃) ₂ | | | | O |
| Phenyl | | | H | cyclo-Propyl | | | -N=C(CH ₃) ₂ | | | | O |
| 2-F-Phenylthio | | | H | cyclo-Propyl | | | -N=C(CH ₃) ₂ | | | | O |
| 3-F-Phenyl | | | H | cyclo-Propyl | | | -N=C(CH ₃) ₂ | | | | O |
| 2,4-(F,F)-Phenyl | | | H | cyclo-Propyl | | | -N=C(CH ₃) ₂ | | | | O |
| 2-Cl-Phenyl | | | H | cyclo-Propyl | | | -N=C(CH ₃) ₂ | | | | O |
| 3-Cl-Phenyl | | | H | cyclo-Propyl | | | -N=C(CH ₃) ₂ | | | | O |
| 2,4-(Cl,Cl)-Phenyl | | | H | cyclo-Propyl | | | -N=C(CH ₃) ₂ | | | | O |
| 2-CH ₃ -Phenyl | | | H | cyclo-Propyl | | | -N=C(CH ₃) ₂ | | | | O |
| 3-CH ₃ -Phenyl | | | H | cyclo-Propyl | | | -N=C(CH ₃) ₂ | | | | O |
| 4-CH ₃ -Phenyl | | | H | cyclo-Propyl | | | -N=C(CH ₃) ₂ | | | | O |
| 2,4-(CH ₃ ,CH ₃)-Phenyl | | | H | cyclo-Propyl | | | -N=C(CH ₃) ₂ | | | | O |
| 2,4,6-(CH ₃ ,CH ₃ ,CH ₃)-Phenyl | | | H | cyclo-Propyl | | | -N=C(CH ₃) ₂ | | | | O |
| 2-CF ₃ -Phenyl | | | H | cyclo-Propyl | | | -N=C(CH ₃) ₂ | | | | O |
| 2-OCH ₃ -Phenyl | | | H | cyclo-Propyl | | | -N=C(CH ₃) ₂ | | | | O |
| 2,4-(OCH ₃ ,OCH ₃)-Phenyl | | | H | cyclo-Propyl | | | -N=C(CH ₃) ₂ | | | | O |
| 4-OCF ₃ -Phenyl | | | H | cyclo-Propyl | | | -N=C(CH ₃) ₂ | | | | O |
| 4-SCH ₃ -Phenyl | | | H | cyclo-Propyl | | | -N=C(CH ₃) ₂ | | | | O |
| 3-SCF ₃ -Phenyl | | | H | cyclo-Propyl | | | -N=C(CH ₃) ₂ | | | | O |
| 2,4-(NO ₂ ,NO ₂)-Phenyl | | | H | cyclo-Propyl | | | -N=C(CH ₃) ₂ | | | | O |
| 4-NO ₂ -Phenyl | | | H | cyclo-Propyl | | | -N=C(CH ₃) ₂ | | | | O |
| 2-Thienyl | | | H | cyclo-Propyl | | | -N=C(CH ₃) ₂ | | | | O |
| 3-Thienyl | | | H | cyclo-Propyl | | | -N=C(CH ₃) ₂ | | | | O |

| R1 | R3 | R4 | R5 | Y |
|------------------------|----|--------------|-------------------------------------|---|
| 2-Furanyl | H | cyclo-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 3-Furanyl | H | cyclo-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 2-Tetrahydrofuran-2-yl | H | cyclo-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 3-Tetrahydrofuran-3-yl | H | cyclo-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 2-Pyridyl | H | cyclo-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 3-Pyridyl | H | cyclo-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 4-Pyridyl | H | cyclo-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 2-Tetrahydropyran-2-yl | H | cyclo-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 3-Tetrahydropyran-3-yl | H | cyclo-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 4-Tetrahydropyran-4-yl | H | cyclo-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| Chlor | H | Methyl | H | 0 |
| Chlor | H | Ethyl | H | 0 |
| Chlor | H | n-Propyl | H | 0 |
| Chlor | H | iso-Propyl | H | 0 |
| Chlor | H | n-Butyl | H | 0 |
| Chlor | H | iso-Butyl | H | 0 |
| Methyl | H | sek.-Butyl | H | 0 |
| Methyl | H | n-Pentyl | H | 0 |
| Methyl | H | 2-Pentyl | H | 0 |
| Methyl | H | 3-Pentyl | H | 0 |
| Methyl | H | n-Hexyl | H | 0 |
| Methyl | H | 2-Hexyl | H | 0 |
| iso-Propyl | H | 3-Hexyl | H | 0 |

| | R ¹ | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | Y |
|----|----------------|----------------|----------------------------|----------------|---|
| 5 | | | | | |
| 10 | | | | | |
| 15 | | | | | |
| 20 | | | | | |
| 25 | | | | | |
| 30 | | | | | |
| 35 | | | | | |
| 40 | | | | | |
| 45 | | | | | |
| 50 | | | | | |
| 55 | | | | | |
| | iso-Propyl | H | 2-Methyl-2-pentyl | H | 0 |
| | iso-Propyl | H | cyclo-Propylmethyl | H | 0 |
| | iso-Propyl | H | cyclo-Butyl | H | 0 |
| | iso-Propyl | H | cyclo-Pentyl | H | 0 |
| | iso-Propyl | H | cyclo-Hexyl | H | 0 |
| | cyclo-Propyl | H | 1-Methylcyclohexyl | H | 0 |
| | cyclo-Propyl | H | 3-Trifluormethylcyclohexyl | H | 0 |
| | cyclo-Propyl | H | Allyl | H | 0 |
| | cyclo-Propyl | H | 1-Buten-3-yl | H | 0 |
| | cyclo-Propyl | H | Crotyl | H | 0 |
| | cyclo-Propyl | H | Propargyl | H | 0 |
| | Allyl | H | 1-Butin-3-yl | H | 0 |
| | Allyl | H | 3-Methyl-1-butin-3-yl | H | 0 |
| | Allyl | H | 2-Pentin-4-yl | H | 0 |
| | Allyl | H | Benzyl | H | 0 |
| | Allyl | H | 2-Phenylethyl | H | 0 |
| | Allyl | H | 2-Methylthioethyl | H | 0 |
| | Ethinyl | H | 2-Chlorethyl | H | 0 |
| | Ethinyl | H | 2-Methoxyethyl | H | 0 |
| | Ethinyl | H | 2-(N,N-Dimethylamino)ethyl | H | 0 |
| | Ethinyl | H | Phenyl | H | 0 |
| | Ethinyl | H | 2-CH ₃ -Phenyl | H | 0 |
| | Ethinyl | H | 4-CH ₃ -Phenyl | H | 0 |

| | 55 | 50 | 45 | 40 | 35 | 30 | 25 | 20 | 15 | 10 | 5 |
|----------------------|----|--|----|----|----|----|----|----|----|----|---|
| R1 | R3 | R4 | R5 | Y | | | | | | | |
| Methoxy | H | 2, 4-(CH ₃ , CH ₃)-Phenyl | H | 0 | | | | | | | |
| Methoxy | H | 2, 3, 5-(CH ₃ , CH ₃ , CH ₃)-Phenyl | H | 0 | | | | | | | |
| Methoxy | H | 3-CF ₃ -Phenyl | H | 0 | | | | | | | |
| Methoxy | H | 3-F-Phenyl | H | 0 | | | | | | | |
| Methoxy | H | 2-Cl-Phenyl | H | 0 | | | | | | | |
| Methoxy | H | 4-Cl-Phenyl | H | 0 | | | | | | | |
| 4-Cl-Phenoxy | H | 2, 4-(F, F)-Phenyl | H | 0 | | | | | | | |
| 4-Cl-Phenoxy | H | 2, 3, 5-(Cl, Cl, Cl)-Phenyl | H | 0 | | | | | | | |
| 4-Cl-Phenoxy | H | 2-CN-Phenyl | H | 0 | | | | | | | |
| 4-Cl-Phenoxy | H | 2-OCH ₃ -Phenyl | H | 0 | | | | | | | |
| 4-Cl-Phenoxy | H | 2, 3-(OCH ₃ , OCH ₃)-Phenyl | H | 0 | | | | | | | |
| 4-Cl-Phenoxy | H | 3, 4, 5-(OCH ₃ , OCH ₃ , OCH ₃)-Phenyl | H | 0 | | | | | | | |
| Phenylthio | H | 3-OCF ₃ -Phenyl | H | 0 | | | | | | | |
| Phenylthio | H | 4-OCF ₂ CHF ₂ -Phenyl | H | 0 | | | | | | | |
| Phenylthio | H | 2-SCH ₃ -Phenyl | H | 0 | | | | | | | |
| Phenylthio | H | 2, 4-(SCH ₃ , SCH ₃)-Phenyl | H | 0 | | | | | | | |
| Phenylthio | H | 2-SCF ₃ -Phenyl | H | 0 | | | | | | | |
| Phenylthio | H | 4-NO ₂ -Phenyl | H | 0 | | | | | | | |
| 2, 4-(Cl, Cl)-Phenyl | H | 2, 4-(NO ₂ , NO ₂)-Phenyl | H | 0 | | | | | | | |
| 2, 4-(Cl, Cl)-Phenyl | H | 2-CHO-Phenyl | H | 0 | | | | | | | |
| 2, 4-(Cl, Cl)-Phenyl | H | 3-COCH ₃ -Phenyl | H | 0 | | | | | | | |
| 2, 4-(Cl, Cl)-Phenyl | H | 3-COCF ₃ -Phenyl | H | 0 | | | | | | | |
| 2, 4-(Cl, Cl)-Phenyl | H | 1-Naphthyl | H | 0 | | | | | | | |

| R ¹ | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | Y |
|---------------------|----------------|---------------------------------------|-------------------------------------|---|
| 2,4-(Cl, Cl)-Phenyl | H | 2-Naphthyl | H | 0 |
| 2-Thienyl | H | Piperidino | H | 0 |
| 2-Thienyl | H | 3-Tetrahydrofuran-2-yl | H | 0 |
| 2-Thienyl | H | 4-Tetrahydropyran-2-yl | H | 0 |
| 2-Thienyl | H | 2-Thiazolyl | H | 0 |
| 2-Thienyl | H | 5-CH ₃ -2-Thiazolyl | H | 0 |
| 2-Thienyl | H | 4-CH ₃ -5-COOH-2-Thiazolyl | H | 0 |
| 3-Pyridyl | H | Methyl | H | 0 |
| 3-Pyridyl | H | Ethyl | H | 0 |
| 3-Pyridyl | H | n-Propyl | H | 0 |
| 3-Pyridyl | H | iso-Propyl | H | 0 |
| 3-Pyridyl | H | n-Butyl | H | 0 |
| 3-Pyridyl | H | iso-Butyl | H | 0 |
| iso-Propyl | Methyl | sek.-Butyl | H | 0 |
| iso-Propyl | Methyl | n-Pentyl | H | 0 |
| iso-Propyl | Methyl | 2-Pentyl | H | 0 |
| iso-Propyl | Methyl | 3-Pentyl | H | 0 |
| iso-Propyl | Methyl | n-Hexyl | H | 0 |
| iso-Propyl | Methyl | 2-Hexyl | H | 0 |
| iso-Propyl | Methyl | 3-Hexyl | H | 0 |
| Chlor | H | Methyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| Chlor | H | Ethyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| Chlor | H | n-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |

| R1 | R3 | R4 | R5 | Y |
|--------------|----|----------------------------|-------------------------------------|---|
| Chlor | H | iso-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| Chlor | H | n-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| Chlor | H | iso-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| Methyl | H | sek.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| Methyl | H | n-Pentyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| Methyl | H | 2-Pentyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| Methyl | H | 3-Pentyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| Methyl | H | n-Hexyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| Methyl | H | 2-Hexyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| iso-Propyl | H | 3-Hexyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| iso-Propyl | H | 2-Methyl-2-pentyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| iso-Propyl | H | cyclo-Propylmethyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| iso-Propyl | H | cyclo-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| iso-Propyl | H | cyclo-Pentyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| iso-Propyl | H | cyclo-Hexyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| cyclo-Propyl | H | 1-Methylcyclohexyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| cyclo-Propyl | H | 3-Trifluormethylcyclohexyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| cyclo-Propyl | H | Allyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| cyclo-Propyl | H | 1-Buten-3-yl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| cyclo-Propyl | H | Crotyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| cyclo-Propyl | H | Propargyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| Allyl | H | 1-Butin-3-yl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| Allyl | H | 3-Methyl-1-butin-3-yl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |

| 55 | 60 | 65 | 70 | 75 | 80 | 85 | 90 | 95 | 100 | 105 | 110 | 115 | 120 | 125 | 130 | 135 | 140 | 145 | 150 | 155 | 160 | 165 | 170 | 175 | 180 | 185 | 190 | 195 | 200 | 205 | 210 | 215 | 220 | 225 | 230 | 235 | 240 | 245 | 250 | 255 | 260 | 265 | 270 | 275 | 280 | 285 | 290 | 295 | 300 | 305 | 310 | 315 | 320 | 325 | 330 | 335 | 340 | 345 | 350 | 355 | 360 | 365 | 370 | 375 | 380 | 385 | 390 | 395 | 400 | 405 | 410 | 415 | 420 | 425 | 430 | 435 | 440 | 445 | 450 | 455 | 460 | 465 | 470 | 475 | 480 | 485 | 490 | 495 | 500 | 505 | 510 | 515 | 520 | 525 | 530 | 535 | 540 | 545 | 550 | 555 | 560 | 565 | 570 | 575 | 580 | 585 | 590 | 595 | 600 | 605 | 610 | 615 | 620 | 625 | 630 | 635 | 640 | 645 | 650 | 655 | 660 | 665 | 670 | 675 | 680 | 685 | 690 | 695 | 700 | 705 | 710 | 715 | 720 | 725 | 730 | 735 | 740 | 745 | 750 | 755 | 760 | 765 | 770 | 775 | 780 | 785 | 790 | 795 | 800 | 805 | 810 | 815 | 820 | 825 | 830 | 835 | 840 | 845 | 850 | 855 | 860 | 865 | 870 | 875 | 880 | 885 | 890 | 895 | 900 | 905 | 910 | 915 | 920 | 925 | 930 | 935 | 940 | 945 | 950 | 955 | 960 | 965 | 970 | 975 | 980 | 985 | 990 | 995 | 1000 |
|--------------|----|--|-------------------------------------|----|----|----|----|----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|------|
| R1 | R3 | R4 | R5 | Y | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | |
| Allyl | H | 2-Pentyl-4-yl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | |
| Allyl | H | Benzyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | |
| Allyl | H | 2-Phenylethyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | |
| Allyl | H | 2-Methylthioethyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | |
| Ethynyl | H | 2-Chlorethyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | |
| Ethynyl | H | 2-Methoxyethyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | |
| Ethynyl | H | 2-(n,N-Dimethylamino)ethyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | |
| Ethynyl | H | Phenyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | |
| Ethynyl | H | 2-CH ₃ -Phenyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | |
| Ethynyl | H | 4-CH ₃ -Phenyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | |
| Methoxy | H | 2,4-(CH ₃ , CH ₃)-Phenyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | |
| Methoxy | H | 2,3,5-(CH ₃ , CH ₃ , CH ₃)-Phenyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | |
| Methoxy | H | 3-CF ₃ -Phenyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | |
| Methoxy | H | 3-F-Phenyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | |
| Methoxy | H | 2-Cl-Phenyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | |
| Methoxy | H | 4-Cl-Phenyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | |
| 4-Cl-Phenoxy | H | 2,4-(F, F)-Phenyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | |
| 4-Cl-Phenoxy | H | 2,3,5-(Cl, Cl, Cl)-Phenyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | |
| 4-Cl-Phenoxy | H | 2-CN-Phenyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | |
| 4-Cl-Phenoxy | H | 2-OCH ₃ -Phenyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | |
| 4-Cl-Phenoxy | H | 2,3-(OCH ₃ , OCH ₃)-Phenyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | |
| 4-Cl-Phenoxy | H | 3,4,5-(OCH ₃ , OCH ₃ , OCH ₃)-Phenyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | |
| Phenylthio | H | 3-OCF ₃ -Phenyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | | |

| | 55 | 50 | 45 | 40 | 35 | 30 | 25 | 20 | 15 | 10 | 5 |
|--------------------|----|--|-------------------------------------|----|----|----|----|----|----|----|---|
| R1 | R3 | R4 | R5 | Y | | | | | | | |
| Phenylthio | H | 4-OCF ₂ CH ₂ -Phenyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | | | | | | | |
| Phenylthio | H | 2-SCH ₃ -Phenyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | | | | | | | |
| Phenylthio | H | 2,4-(SCH ₃ ,SCH ₃)-Phenyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | | | | | | | |
| Phenylthio | H | 2-SCF ₃ -Phenyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | | | | | | | |
| Phenylthio | H | 4-NO ₂ -Phenyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | | | | | | | |
| 2,4-(Cl,Cl)-Phenyl | H | 2,4-(NO ₂ ,NO ₂)-Phenyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | | | | | | | |
| 2,4-(Cl,Cl)-Phenyl | H | 2-CHO-Phenyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | | | | | | | |
| 2,4-(Cl,Cl)-Phenyl | H | 3-COCH ₃ -Phenyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | | | | | | | |
| 2,4-(Cl,Cl)-Phenyl | H | 3-COCF ₃ -Phenyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | | | | | | | |
| 2,4-(Cl,Cl)-Phenyl | H | 1-Naphthyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | | | | | | | |
| 2,4-(Cl,Cl)-Phenyl | H | 2-Naphthyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | | | | | | | |
| 2-Thienyl | H | Piperidino | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | | | | | | | |
| 2-Thienyl | H | 3-Tetrahydrofuryl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | | | | | | | |
| 2-Thienyl | H | 4-Tetrahydropyryl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | | | | | | | |
| 2-Thienyl | H | 2-Thiazolyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | | | | | | | |
| 2-Thienyl | H | 5-CH ₃ -2-Thiazolyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | | | | | | | |
| 2-Thienyl | H | 4-CH ₃ -5-COOH-2-Thiazolyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | | | | | | | |
| 3-Pyridyl | H | Methyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | | | | | | | |
| 3-Pyridyl | H | Ethyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | | | | | | | |
| 3-Pyridyl | H | n-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | | | | | | | |
| 3-Pyridyl | H | iso-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | | | | | | | |
| 3-Pyridyl | H | n-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | | | | | | | |
| 3-Pyridyl | H | iso-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | | | | | | | |

| R1 | R3 | R4 | R5 | Y |
|--------------|--------|-------------|-------------------------------------|---|
| iso-Propyl | Methyl | sek.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | O |
| iso-Propyl | Methyl | n-Pentyl | -N=C(CH ₃) ₂ | O |
| iso-Propyl | Methyl | 2-Pentyl | -N=C(CH ₃) ₂ | O |
| iso-Propyl | Methyl | 3-Pentyl | -N=C(CH ₃) ₂ | O |
| iso-Propyl | Methyl | n-Hexyl | -N=C(CH ₃) ₂ | O |
| iso-Propyl | Methyl | 2-Hexyl | -N=C(CH ₃) ₂ | O |
| iso-Propyl | Methyl | 3-Hexyl | -N=C(CH ₃) ₂ | O |
| Methyl | H | tert.-Butyl | 2,4-(Cl, Cl)-Phenyl | S |
| Methyl | H | tert.-Butyl | 2-Pyridyl | S |
| Methyl | H | tert.-Butyl | Ethyl | S |
| Methyl | H | tert.-Butyl | iso-Propyl | S |
| Methyl | H | tert.-Butyl | Butyl | S |
| Methyl | H | tert.-Butyl | tert.-Butyl | S |
| Methyl | H | tert.-Butyl | Phenyl | S |
| iso-Propyl | H | tert.-Butyl | 4-F-Phenyl | S |
| iso-Propyl | H | tert.-Butyl | 3-CF ₃ -Phenyl | S |
| iso-Propyl | H | tert.-Butyl | 2,4-(Cl, Cl)-Phenyl | S |
| iso-Propyl | H | tert.-Butyl | 2-Pyridyl | S |
| iso-Propyl | H | tert.-Butyl | Methyl | S |
| iso-Propyl | H | tert.-Butyl | Ethyl | S |
| iso-Propyl | H | tert.-Butyl | iso-Propyl | S |
| cyclo-Propyl | H | tert.-Butyl | Butyl | S |
| cyclo-Propyl | H | tert.-Butyl | tert.-Butyl | S |

| | 55 | 50 | 45 | 40 | 35 | 30 | 25 | 20 | 15 | 10 | 5 |
|----------------|----------------|----------------|---------------------------|----|----|----|----|----|----|----|---|
| R ¹ | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | Y | | | | | | | |
| cyclo-Propyl | H | tert.-Butyl | Phenyl | S | | | | | | | |
| cyclo-Propyl | H | tert.-Butyl | 4-F-Phenyl | S | | | | | | | |
| cyclo-Propyl | H | tert.-Butyl | 3-CF ₃ -Phenyl | S | | | | | | | |
| cyclo-Propyl | H | tert.-Butyl | 2,4-(Cl,Cl)-Phenyl | S | | | | | | | |
| cyclo-Propyl | H | tert.-Butyl | 2-Pyridyl | S | | | | | | | |
| Allyl | H | tert.-Butyl | Methyl | S | | | | | | | |
| Allyl | H | tert.-Butyl | Ethyl | S | | | | | | | |
| Allyl | H | tert.-Butyl | iso-Propyl | S | | | | | | | |
| Allyl | H | tert.-Butyl | Butyl | S | | | | | | | |
| Allyl | H | tert.-Butyl | tert.-Butyl | S | | | | | | | |
| Allyl | H | tert.-Butyl | Phenyl | S | | | | | | | |
| Methoxy | H | tert.-Butyl | Methyl | S | | | | | | | |
| Methoxy | H | tert.-Butyl | Ethyl | S | | | | | | | |
| Methoxy | H | tert.-Butyl | iso-Propyl | S | | | | | | | |
| Methoxy | H | tert.-Butyl | Butyl | S | | | | | | | |
| Methoxy | H | tert.-Butyl | tert.-Butyl | S | | | | | | | |
| Methoxy | H | tert.-Butyl | Phenyl | S | | | | | | | |
| Methoxy | H | tert.-Butyl | Methyl | S | | | | | | | |
| Methoxy | H | tert.-Butyl | Ethyl | S | | | | | | | |
| Methoxy | H | tert.-Butyl | iso-Propyl | S | | | | | | | |
| Methoxy | H | tert.-Butyl | Butyl | S | | | | | | | |
| Methoxy | H | tert.-Butyl | tert.-Butyl | S | | | | | | | |
| Methoxy | H | tert.-Butyl | Phenyl | S | | | | | | | |
| Methoxy | H | tert.-Butyl | 4-F-Phenyl | S | | | | | | | |
| 4-Cl-Phenoxy | H | tert.-Butyl | 3-CF ₃ -Phenyl | S | | | | | | | |
| 4-Cl-Phenoxy | H | tert.-Butyl | 2,4-(Cl,Cl)-Phenyl | S | | | | | | | |
| 4-Cl-Phenoxy | H | tert.-Butyl | 2-Pyridyl | S | | | | | | | |
| 4-Cl-Phenoxy | H | tert.-Butyl | Methyl | S | | | | | | | |
| 4-Cl-Phenoxy | H | tert.-Butyl | Ethyl | S | | | | | | | |

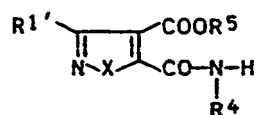
| 55 | 50 | 45 | 40 | 35 | 30 | 25 | 20 | 15 | 10 | 5 |
|--------------------|----------------|----------------|---------------------------|----|----|----|----|----|----|---|
| R ¹ | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | Y | | | | | | |
| 4-Cl-Phenoxy | H | tert.-Butyl | iso-Propyl | S | | | | | | |
| 4-Cl-Phenoxy | H | tert.-Butyl | Butyl | S | | | | | | |
| 2,4-(Cl,Cl)-Phenyl | H | tert.-Butyl | tert.-Butyl | S | | | | | | |
| 2,4-(Cl,Cl)-Phenyl | H | tert.-Butyl | Phenyl | S | | | | | | |
| 2,4-(Cl,Cl)-Phenyl | H | tert.-Butyl | 4-F-Phenyl | S | | | | | | |
| 2,4-(Cl,Cl)-Phenyl | H | tert.-Butyl | 3-CF ₃ -Phenyl | S | | | | | | |
| 2,4-(Cl,Cl)-Phenyl | H | tert.-Butyl | 2,4-(Cl,Cl)-Phenyl | S | | | | | | |
| 2,4-(Cl,Cl)-Phenyl | H | tert.-Butyl | 2-Pyridyl | S | | | | | | |
| 2,4-(Cl,Cl)-Phenyl | H | tert.-Butyl | Ethyl | S | | | | | | |
| 2-Thienyl | H | tert.-Butyl | iso-Propyl | S | | | | | | |
| 2-Thienyl | H | tert.-Butyl | Butyl | S | | | | | | |
| 2-Thienyl | H | tert.-Butyl | tert.-Butyl | S | | | | | | |
| 3-Pyridyl | H | tert.-Butyl | Phenyl | S | | | | | | |
| 3-Pyridyl | H | tert.-Butyl | 4-F-Phenyl | S | | | | | | |
| 3-Pyridyl | H | tert.-Butyl | 3-CF ₃ -Phenyl | S | | | | | | |
| Methyl | H | cyclo-Propyl | 2,4-(Cl,Cl)-Phenyl | S | | | | | | |
| Methyl | H | cyclo-Propyl | 2-Pyridyl | S | | | | | | |
| Methyl | H | cyclo-Propyl | Ethyl | S | | | | | | |
| Methyl | H | cyclo-Propyl | iso-Propyl | S | | | | | | |
| Methyl | H | cyclo-Propyl | Butyl | S | | | | | | |
| Methyl | H | cyclo-Propyl | tert.-Butyl | S | | | | | | |
| Methyl | H | cyclo-Propyl | Phenyl | S | | | | | | |
| iso-Propyl | H | cyclo-Propyl | 4-F-Phenyl | S | | | | | | |

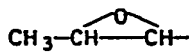
| 55 | 50 | 45 | 40 | 35 | 30 | 25 | 20 | 15 | 10 | 5 |
|----------------|----------------|----------------|---------------------------|----|----|----|----|----|----|---|
| R ¹ | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | Y | | | | | | |
| Iso-Propyl | H | cyclo-Propyl | 3-CF ₃ -Phenyl | S | | | | | | |
| Iso-Propyl | H | cyclo-Propyl | 2,4-(Cl,Cl)-Phenyl | S | | | | | | |
| Iso-Propyl | H | cyclo-Propyl | 2-Pyridyl | S | | | | | | |
| Iso-Propyl | H | cyclo-Propyl | Methyl | S | | | | | | |
| Iso-Propyl | H | cyclo-Propyl | Ethyl | S | | | | | | |
| Iso-Propyl | H | cyclo-Propyl | iso-Propyl | S | | | | | | |
| cyclo-Propyl | H | cyclo-Propyl | Butyl | S | | | | | | |
| cyclo-Propyl | H | cyclo-Propyl | tert.-Butyl | S | | | | | | |
| cyclo-Propyl | H | cyclo-Propyl | Phenyl | S | | | | | | |
| cyclo-Propyl | H | cyclo-Propyl | 4-F-Phenyl | S | | | | | | |
| cyclo-Propyl | H | cyclo-Propyl | 3-CF ₃ -Phenyl | S | | | | | | |
| cyclo-Propyl | H | cyclo-Propyl | 2,4-(Cl,Cl)-Phenyl | S | | | | | | |
| cyclo-Propyl | H | cyclo-Propyl | 2-Pyridyl | S | | | | | | |
| Allyl | H | cyclo-Propyl | Methyl | S | | | | | | |
| Allyl | H | cyclo-Propyl | Ethyl | S | | | | | | |
| Allyl | H | cyclo-Propyl | iso-Propyl | S | | | | | | |
| Allyl | H | cyclo-Propyl | Butyl | S | | | | | | |
| Allyl | H | cyclo-Propyl | tert.-Butyl | S | | | | | | |
| Allyl | H | cyclo-Propyl | Phenyl | S | | | | | | |
| Methoxy | H | cyclo-Propyl | Methyl | S | | | | | | |
| Methoxy | H | cyclo-Propyl | Ethyl | S | | | | | | |
| Methoxy | H | cyclo-Propyl | iso-Propyl | S | | | | | | |
| Methoxy | H | cyclo-Propyl | Butyl | S | | | | | | |

| R1 | R3 | R4 | R5 | Y |
|---------------------|----|--------------|---------------------------|---|
| Methoxy | H | cyclo-Propyl | tert.-Butyl | S |
| Methoxy | H | cyclo-Propyl | Phenyl | S |
| Methoxy | H | cyclo-Propyl | 4-F-Phenyl | S |
| 4-Cl-Phenoxy | H | cyclo-Propyl | 3-CF ₃ -Phenyl | S |
| 4-Cl-Phenoxy | H | cyclo-Propyl | 2,4-(Cl, Cl)-Phenyl | S |
| 4-Cl-Phenoxy | H | cyclo-Propyl | 2-Pyridyl | S |
| 4-Cl-Phenoxy | H | cyclo-Propyl | Methyl | S |
| 4-Cl-Phenoxy | H | cyclo-Propyl | Ethyl | S |
| 4-Cl-Phenoxy | H | cyclo-Propyl | iso-Propyl | S |
| 4-Cl-Phenoxy | H | cyclo-Propyl | Butyl | S |
| 2,4-(Cl, Cl)-Phenyl | H | cyclo-Propyl | tert.-Butyl | S |
| 2,4-(Cl, Cl)-Phenyl | H | cyclo-Propyl | Phenyl | S |
| 2,4-(Cl, Cl)-Phenyl | H | cyclo-Propyl | 4-F-Phenyl | S |
| 2,4-(Cl, Cl)-Phenyl | H | cyclo-Propyl | 3-CF ₃ -Phenyl | S |
| 2,4-(Cl, Cl)-Phenyl | H | cyclo-Propyl | 2,4-(Cl, Cl)-Phenyl | S |
| 2,4-(Cl, Cl)-Phenyl | H | cyclo-Propyl | 2-Pyridyl | S |
| 2,4-(Cl, Cl)-Phenyl | H | cyclo-Propyl | Ethyl | S |
| 2-Thienyl | H | cyclo-Propyl | iso-Propyl | S |
| 2-Thienyl | H | cyclo-Propyl | Butyl | S |
| 2-Thienyl | H | cyclo-Propyl | tert.-Butyl | S |
| 3-Pyridyl | H | cyclo-Propyl | Phenyl | S |
| 3-Pyridyl | H | cyclo-Propyl | 4-F-Phenyl | S |
| 3-Pyridyl | H | cyclo-Propyl | 3-CF ₃ -Phenyl | S |

Tabelle 2

5

R² = COOHR³ = H

| 10 | R ^{1'} | R ⁴ | R ⁵ | X |
|----|---|----------------|----------------|---|
| | Cyclopropyl-CH(CH ₃)- | tert.-Butyl | H | 0 |
| | Cyclopropyl-CH(C ₂ H ₅)- | tert.-Butyl | H | 0 |
| | CH ₂ =CH- | tert.-Butyl | H | 0 |
| 15 | E-CH ₃ -CH=CH- | tert.-Butyl | H | 0 |
| | Z-CH ₃ -CH=CH- | tert.-Butyl | H | 0 |
| | CH ₂ =CH-CH ₂ - | tert.-Butyl | H | 0 |
| | CH ₂ =C(CH ₃)- | tert.-Butyl | H | 0 |
| 20 | C ₂ H ₅ -CH=CH- | tert.-Butyl | H | 0 |
| | CH ₃ -CH=C(CH ₃)- | tert.-Butyl | H | 0 |
| | CH ₂ =C(C ₂ H ₅)- | tert.-Butyl | H | 0 |
| | CH ₃ -CH=C(C ₂ H ₅)- | tert.-Butyl | H | 0 |
| | (CH ₃) ₂ C=CH- | tert.-Butyl | H | 0 |
| 25 | CH ₂ =C(CH ₃)-CH(CH ₃)- | tert.-Butyl | H | 0 |
| | (CH ₃) ₂ C=CH-CH ₂ - | tert.-Butyl | H | 0 |
| | CH ₃ -CCl=CH- | tert.-Butyl | H | 0 |
| | Cl ₂ C=CH- | tert.-Butyl | H | 0 |
| 30 | Cyclopent-1-en | tert.-Butyl | H | 0 |
| | Cyclohex-1-en | tert.-Butyl | H | 0 |
| | 1-CH ₃ -Cyclohex-2-en | tert.-Butyl | H | 0 |
| | E-Phenyl-CH=CH- | tert.-Butyl | H | 0 |
| 35 | E-4-(CH ₃ O)-C ₆ H ₅ -CH=CH- | tert.-Butyl | H | 0 |
| | HC≡C- | tert.-Butyl | H | 0 |
| | CH ₃ -C≡C- | tert.-Butyl | H | 0 |
| | HC≡C-CH ₂ - | tert.-Butyl | H | 0 |
| 40 | Phenyl-C≡C- | tert.-Butyl | H | 0 |
| |  | tert.-Butyl | H | 0 |
| | Cyclopropyl-CH(CH ₃)- | Cyclopropyl | H | 0 |
| 45 | Cyclopropyl-CH(C ₂ H ₅)- | Cyclopropyl | H | 0 |
| | CH ₂ =CH- | Cyclopropyl | H | 0 |
| | E-CH ₃ -CH=CH- | Cyclopropyl | H | 0 |
| | Z-CH ₃ -CH=CH- | Cyclopropyl | H | 0 |
| 50 | CH ₂ =CH-CH ₂ - | Cyclopropyl | H | 0 |
| | CH ₂ =C(CH ₃)- | Cyclopropyl | H | 0 |
| | C ₂ H ₅ -CH=CH- | Cyclopropyl | H | 0 |

55

Tabelle 2 (Fortsetzung)

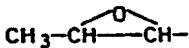
| | R1' | R4 | R5 | X |
|----|--|---------------------------------------|----|---|
| 5 | CH ₃ -CH=C(CH ₃)- | Cyclopropyl | H | 0 |
| | CH ₂ =C(C ₂ H ₅)- | Cyclopropyl | H | 0 |
| | CH ₃ -CH=C(C ₂ H ₅)- | Cyclopropyl | H | 0 |
| | (CH ₃) ₂ C=CH- | Cyclopropyl | H | 0 |
| 10 | CH ₂ =C(CH ₃)-CH(CH ₃)- | Cyclopropyl | H | 0 |
| | (CH ₃) ₂ C=CH-CH ₂ - | Cyclopropyl | H | 0 |
| | CH ₃ -CCl=CH- | Cyclopropyl | H | 0 |
| | Cl ₂ C=CH- | Cyclopropyl | H | 0 |
| | Cyclopent-1-en | Cyclopropyl | H | 0 |
| 15 | Cyclohex-1-en | Cyclopropyl | H | 0 |
| | 1-CH ₃ -Cyclohex-2-en | Cyclopropyl | H | 0 |
| | E-Phenyl-CH=CH- | Cyclopropyl | H | 0 |
| | E-4-(CH ₃ O)-C ₆ H ₅ -CH=CH- | Cyclopropyl | H | 0 |
| 20 | HC≡C- | Cyclopropyl | H | 0 |
| | CH ₃ -C≡C- | Cyclopropyl | H | 0 |
| | HC≡C-CH ₂ - | Cyclopropyl | H | 0 |
| | Phenyl-C≡C- | Cyclopropyl | H | 0 |
| 25 |  -CH- | Cyclopropyl | H | 0 |
| | Cyclopropyl-CH(CH ₃)- | C(CH ₃) ₂ C≡CH | H | 0 |
| | Cyclopropyl-CH(C ₂ H ₅)- | C(CH ₃) ₂ C≡CH | H | 0 |
| 30 | CH ₂ =CH- | C(CH ₃) ₂ C≡CH | H | 0 |
| | E-CH ₃ -CH=CH- | C(CH ₃) ₂ C≡CH | H | 0 |
| | Z-CH ₃ -CH=CH- | C(CH ₃) ₂ C≡CH | H | 0 |
| | CH ₂ =CH-CH ₂ - | C(CH ₃) ₂ C≡CH | H | 0 |
| 35 | CH ₂ =C(CH ₃)- | C(CH ₃) ₂ C≡CH | H | 0 |
| | C ₂ H ₅ -CH=CH- | C(CH ₃) ₂ C≡CH | H | 0 |
| | CH ₃ -CH=C(CH ₃)- | C(CH ₃) ₂ C≡CH | H | 0 |
| | CH ₂ =C(C ₂ H ₅)- | C(CH ₃) ₂ C≡CH | H | 0 |
| 40 | CH ₃ -CH=C(C ₂ H ₅)- | C(CH ₃) ₂ C≡CH | H | 0 |
| | (CH ₃) ₂ C=CH- | C(CH ₃) ₂ C≡CH | H | 0 |
| | CH ₂ =C(CH ₃)-CH(CH ₃)- | C(CH ₃) ₂ C≡CH | H | 0 |
| | (CH ₃) ₂ C=CH-CH ₂ - | C(CH ₃) ₂ C≡CH | H | 0 |
| | CH ₃ -CCl=CH- | C(CH ₃) ₂ C≡CH | H | 0 |
| 45 | Cl ₂ C=CH- | C(CH ₃) ₂ C≡CH | H | 0 |
| | Cyclopent-1-en | C(CH ₃) ₂ C≡CH | H | 0 |
| | Cyclohex-1-en | C(CH ₃) ₂ C≡CH | H | 0 |
| | 1-CH ₃ -Cyclohex-2-en | C(CH ₃) ₂ C≡CH | H | 0 |
| 50 | E-Phenyl-CH=CH- | C(CH ₃) ₂ C≡CH | H | 0 |

Tabelle 2 (Fortsetzung)

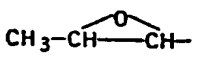
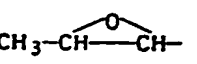
| | R1' | R4 | R5 | X |
|----|---|---------------------------------------|----|---|
| 5 | E-4-(CH ₃ O)-C ₆ H ₅ -CH=CH- | C(CH ₃) ₂ C≡CH | H | 0 |
| | HC≡C- | C(CH ₃) ₂ C≡CH | H | 0 |
| | CH ₃ -C≡C- | C(CH ₃) ₂ C≡CH | H | 0 |
| | HC≡C-CH ₂ - | C(CH ₃) ₂ C≡CH | H | 0 |
| 10 | Phenyl-C≡C- | C(CH ₃) ₂ C≡CH | H | 0 |
| |  | C(CH ₃) ₂ C≡CH | H | 0 |
| | Cyclopropyl-CH(CH ₃)- | C(CH ₃) ₂ C≡N | H | 0 |
| 15 | Cyclopropyl-CH(C ₂ H ₅)- | C(CH ₃) ₂ C≡N | H | 0 |
| | CH ₂ =CH- | C(CH ₃) ₂ C≡N | H | 0 |
| | E-CH ₃ -CH=CH- | C(CH ₃) ₂ C≡N | H | 0 |
| | Z-CH ₃ -CH=CH- | C(CH ₃) ₂ C≡N | H | 0 |
| 20 | CH ₂ =CH-CH ₂ - | C(CH ₃) ₂ C≡N | H | 0 |
| | CH ₂ =C(CH ₃)- | C(CH ₃) ₂ C≡N | H | 0 |
| | C ₂ H ₅ -CH=CH- | C(CH ₃) ₂ C≡N | H | 0 |
| | CH ₃ -CH=C(CH ₃)- | C(CH ₃) ₂ C≡N | H | 0 |
| 25 | CH ₂ =C(C ₂ H ₅)- | C(CH ₃) ₂ C≡N | H | 0 |
| | CH ₃ -CH=C(C ₂ H ₅)- | C(CH ₃) ₂ C≡N | H | 0 |
| | (CH ₃) ₂ C=CH- | C(CH ₃) ₂ C≡N | H | 0 |
| | CH ₂ =C(CH ₃)-CH(CH ₃)- | C(CH ₃) ₂ C≡N | H | 0 |
| 30 | (CH ₃) ₂ C=CH-CH ₂ - | C(CH ₃) ₂ C≡N | H | 0 |
| | CH ₃ -CCl=CH- | C(CH ₃) ₂ C≡N | H | 0 |
| | Cl ₂ C=CH- | C(CH ₃) ₂ C≡N | H | 0 |
| | Cyclopent-1-en | C(CH ₃) ₂ C≡N | H | 0 |
| | Cyclohex-1-en | C(CH ₃) ₂ C≡N | H | 0 |
| 35 | 1-CH ₃ -Cyclohex-2-en | C(CH ₃) ₂ C≡N | H | 0 |
| | E-Phenyl-CH=CH- | C(CH ₃) ₂ C≡N | H | 0 |
| | E-4-(CH ₃ O)-C ₆ H ₅ -CH=CH- | C(CH ₃) ₂ C≡N | H | 0 |
| | HC≡C- | C(CH ₃) ₂ C≡N | H | 0 |
| 40 | CH ₃ -C≡C- | C(CH ₃) ₂ C≡N | H | 0 |
| | HC≡C-CH ₂ - | C(CH ₃) ₂ C≡N | H | 0 |
| | Phenyl-C≡C- | C(CH ₃) ₂ C≡N | H | 0 |
| 45 |  | C(CH ₃) ₂ C≡N | H | 0 |
| | CH ₂ =CH- | tert.-Butyl | H | S |
| | E-CH ₃ -CH=CH- | tert.-Butyl | H | S |
| 50 | E-C ₆ H ₅ -CH=CH- | tert.-Butyl | H | S |
| | CH ₂ =C(CH ₃)- | tert.-Butyl | H | S |

Tabelle 2 (Fortsetzung)

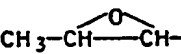
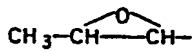
| | R1' | R4 | R5 | X |
|----|---|-------------|-------------------------------------|---|
| 5 | CH ₂ =CH- | Cyclopropyl | H | S |
| | E-CH ₃ -CH=CH- | Cyclopropyl | H | S |
| | E-C ₆ H ₅ -CH=CH- | Cyclopropyl | H | S |
| | CH ₂ =C(CH ₃)- | Cyclopropyl | H | S |
| 10 | Cyclopropyl-CH(CH ₃)- | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| | Cyclopropyl-CH(C ₂ H ₅)- | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| | CH ₂ =CH- | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| | E-CH ₃ -CH=CH- | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| | Z-CH ₃ -CH=CH- | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 15 | CH ₂ =CH-CH ₂ - | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| | CH ₂ =C(CH ₃)- | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| | C ₂ H ₅ -CH=CH- | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| | CH ₃ -CH=C(CH ₃)- | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 20 | CH ₂ =C(C ₂ H ₅)- | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| | CH ₃ -CH=C(C ₂ H ₅)- | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| | (CH ₃) ₂ C=CH- | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| | CH ₂ =C(CH ₃)-CH(CH ₃)- | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 25 | (CH ₃) ₂ C=CH-CH ₂ - | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| | CH ₃ -CCl=CH- | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| | Cl ₂ C=CH- | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| | Cyclopent-1-en | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 30 | Cyclohex-1-en | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| | 1-CH ₃ -Cyclohex-2-en | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| | E-Phenyl-CH=CH- | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| | E-4-(CH ₃ O)-C ₆ H ₅ -CH=CH- | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| | HC≡C- | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 35 | CH ₃ -C≡C- | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| | HC≡C-CH ₂ - | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| | Phenyl-C≡C- | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 40 |  | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| | Cyclopropyl-CH(CH ₃)- | Cyclopropyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| | Cyclopropyl-CH(C ₂ H ₅)- | Cyclopropyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 45 | CH ₂ =CH- | Cyclopropyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| | E-CH ₃ -CH=CH- | Cyclopropyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| | Z-CH ₃ -CH=CH- | Cyclopropyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| | CH ₂ =CH-CH ₂ - | Cyclopropyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 50 | CH ₂ =C(CH ₃)- | Cyclopropyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| | C ₂ H ₅ -CH=CH- | Cyclopropyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |

Tabelle 2 (Fortsetzung)

| | R ¹ | R ⁴ | R ⁵ | X |
|----|---|----------------|-------------------------------------|---|
| 5 | CH ₃ -CH=C(CH ₃)- | Cyclopropyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| | CH ₂ =C(C ₂ H ₅)- | Cyclopropyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| | CH ₃ -CH=C(C ₂ H ₅)- | Cyclopropyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| | (CH ₃) ₂ C=CH- | Cyclopropyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 10 | CH ₂ =C(CH ₃)-CH(CH ₃)- | Cyclopropyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| | (CH ₃) ₂ C=CH-CH ₂ - | Cyclopropyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| | CH ₃ -CCl=CH- | Cyclopropyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| | Cl ₂ C=CH- | Cyclopropyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 15 | Cyclopent-1-en | Cyclopropyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| | Cyclohex-1-en | Cyclopropyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| | 1-CH ₃ -Cyclohex-2-en | Cyclopropyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| | E-Phenyl-CH=CH- | Cyclopropyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| | E-4-(CH ₃ O)-C ₆ H ₅ -CH=CH- | Cyclopropyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 20 | HC≡C- | Cyclopropyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| | CH ₃ -C≡C- | Cyclopropyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| | HC≡C-CH ₂ - | Cyclopropyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| | Phenyl-C≡C- | Cyclopropyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| 25 |  | Cyclopropyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 |
| | CH ₂ =CH- | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | S |
| 30 | E-CH ₃ -CH=CH- | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | S |
| | E-C ₆ H ₅ -CH=CH- | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | S |
| | CH ₂ =C(CH ₃)- | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | S |
| | CH ₂ =CH- | Cyclopropyl | -N=C(CH ₃) ₂ | S |
| | E-CH ₃ -CH=CH- | Cyclopropyl | -N=C(CH ₃) ₂ | S |
| 35 | E-C ₆ H ₅ -CH=CH- | Cyclopropyl | -N=C(CH ₃) ₂ | S |
| | CH ₂ =C(CH ₃)- | Cyclopropyl | -N=C(CH ₃) ₂ | S |

Ganz besonders bevorzugt ist 3-Cyclopropylaminocarbonyl-5-isopropylisoxazol-4-carbonsäure.

Die Carbonsäureamide Ia, Ib, Ic und Id bzw. die sie enthaltenden herbiziden Mittel können beispielsweise in Form von direkt versprühbaren Lösungen, Pulvern, Suspensionen, auch hochprozentigen wäßrigen, öligen oder sonstigen Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln, Streumitteln oder Granulaten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder Gießen angewendet werden. Die Anwendungsformen richten sich nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.

Die Verbindungen Ia, Ib, Ic und Id eignen sich allgemein zur Herstellung von direkt versprühbaren Lösungen, Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen. Als inerte Zusatzstoffe kommen Mineralölfractionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt, wie Kerosin oder Dieselöl, ferner Kohlenteeöle sowie Öle pflanzlichen oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Toluol, Xylol, Paraffin, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naphthaline oder deren Derivate, Methanol, Ethanol, Propanol, Butanol, Cyclohexanol, Cyclohexanon, Chlorbenzol, Isophoron oder stark polare Lösungsmittel, wie N,N-Dimethylformamid, Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon oder Wasser in Betracht.

Wäßrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Dispersionen, Pasten, netzbaren Pulvern oder wasserdispergierbaren Granulaten durch Zusatz von Wasser bereitete werden. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die Substrate als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz, Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell

Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung mit Wasser geeignet sind.

Als oberflächenaktive Stoffe kommen die Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von aromatischen Sulfonsäuren, z.B. Lignin-, Phenol-, Naphthalin- und Dibutylnaphthalinsulfonsäure, sowie von Fettsäuren, Alkyl- und Alkylarylsulfonaten, Alkyl-, Laurylether- und Fettalkoholsulfaten, sowie Salze sulfatierter Hexa-, Hepta- und Octadecanolen, sowie von Fettalkoholglykolether, Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und seiner Derivate mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfonsäuren mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxyethylenoctylphenolether, ethoxyliertes Isooctyl-, Octyl- oder Nonylphenol, Alkylphenol-, Tributylphenylpolyglykolether, Alkylarylpolyetheralkohole, Isotridecylalkohol, Fettalkoholethylenoxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylenalkylether oder Polyoxypropylen, Laurylalkoholpolyglykoletheracetat, Sorbitester, Lignin-Sulfitablaugen oder Methylcellulose in Betracht.

Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen Trägerstoff hergestellt werden.

Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulate können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind Mineralerden wie Silicagel, Kieselensäuren, Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Kalkstein, Kalk, Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte, wie Getreidemehl, Baumrinden-, Holz- und Nußschalenmehl, Cellulosepulver oder andere feste Trägerstoffe.

Die Formulierungen enthalten zwischen 0,01 und 95 Gew.%, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 Gew.%, Wirkstoff. Die Wirkstoffe werden dabei in einer Reinheit von 90 % bis 100 %, vorzugsweise 95 % bis 100 % (nach NMR-Spektrum) eingesetzt.

Beispiele für solche Zubereitungen sind:

I. eine Lösung aus 90 Gew.-Teilen der Verbindung Nr. 3.002 und 10 Gew.-Teilen N-Methyl- α -pyrrolidon, die zur Anwendung in Form kleinster Tropfen geeignet ist;

II. eine Mischung aus 20 Gew.-Teilen der Verbindung Nr. 3.006, 80 Gew.-Teilen Xylol, 10 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 8 bis 10 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ölsäure-N-monoethanolamid, 5 Gew.-Teilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure, 5 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes und 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl. Durch feines Verteilen des Gemisches in 100 000 Gew.-Teilen Wasser erhält man eine Dispersion, die 0,02 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.

III. eine wäßrige Dispersion aus 20 Gew.-Teilen der Verbindung Nr. 3.016, 40 Gew.-Teilen Cyclohexanon, 30 Gew.-Teilen Isobutanol, 20 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 mol Ethylenoxid an 1 mol Ricinusöl. Die Mischung dieser Dispersion mit 100 000 Gewichtsteilen Wasser enthält 0,02 Gew.-% des Wirkstoffes.

IV. eine wäßrige Dispersion aus 20 Gew.-Teilen der Verbindung Nr. 3.020, 25 Gew.-Teilen Cyclohexanol, 65 Gew.-Teilen einer Mineralölfraction vom Siedepunkt 210 bis 280 °C und 10 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 mol Ethylenoxid an 1 mol Ricinusöl. Die Mischung dieser Dispersion mit 100 000 Gew.-Teilen Wasser enthält 0,02 % des Wirkstoffes;

V. eine in einer Hammermühle vermahlene Mischung aus 80 Gew.-Teilen der Verbindung Nr. 3.029, 3 Gew.-Teilen des Natriumsalzes der Diisobutylnaphthalin- α -sulfonsäure, 10 Gew.-Teilen des Natriumsalzes einer Ligninsulfonsäure aus einer Sulfitablauge und 7 Gew.-Teilen pulverförmigem Kiesel säuregel. Durch feines Verteilen der Mischung in 20 000 Gew.-Teilen Wasser erhält man eine Spritzbrühe, die 0,1 Gew.-% des Wirkstoffs enthält;

VI. eine innige Mischung aus 3 Gew.-Teilen der Verbindung Nr. 3.047 und 97 Gew.-Teilen feinteiligem Kaolin. Dieses Stäubemittel enthält 3 Gew.-% Wirkstoff;

VII. eine innige Mischung aus 30 Gew.-Teilen der Verbindung Nr. 3.048, 92 Gew.-Teilen pulverförmigem Kiesel säuregel und 8 Gew.-Teilen Paraffinöl, das auf die Oberfläche dieses Kiesel säuregels gesprüht wurde. Diese Aufbereitung gibt dem Wirkstoff eine gute Haftfähigkeit;

VIII. eine stabile wäßrige Dispersion aus 40 Gew.-Teilen der Verbindung Nr. 6.04, 10 Gew.-Teilen des Natriumsalzes eines Phenosulfonsäure-harnstoff-formaldehyd-Kondensates, 2 Gew.-Teilen Kieselgel und 48 Gew.-Teilen Wasser, die weiter verdünnt werden kann;

IX. eine stabile ölige Dispersion aus 20 Gew.-Teilen der Verbindung Nr. 6.06, 2 Gew.-Teilen des Calciumsalzes der Dodecylbenzolsulfonsäure, 8 Gew.-Teilen Fettalkohol-polyglykolether, 20 Gew.-Teilen des Natriumsalzes eines Phenolsulfonsäure-harnstoffformaldehyd-Kondensates und 68 Gew.-Teilen eines paraffinischen Mineralöls;

X. eine in einer Hammermühle vermahlene Mischung aus 10 Gew.-Teilen der Verbindung Nr. 6.08, 4 Gew.-Teilen des Natriumsalzes der Diisobutylnaphthalin- α -sulfonsäure, 20 Gew.-Teilen des Natriumsalzes einer Ligninsulfonsäure aus einer Sulfitablauge, 38 Gew.-Teilen Kiesel säuregel und 38 Gew.-Teilen

Kaolin. Durch feines Verteilen der Mischung in 10 000 Gew.-Teilen Wasser erhält man eine Spritzbrühe, die 0,1 Gew.% des Wirkstoffs enthält.

Die Applikation der herbiziden Mittel bzw. der Wirkstoffe kann im Vorauf- oder im Nachaufverfahren erfolgen. Sind die Wirkstoffe für gewisse Kulturpflanzen weniger verträglich, so können Ausbringungstechniken angewandt werden, bei welchen die herbiziden Mittel mit Hilfe der Spritzgeräte so gespritzt werden, daß die Blätter der empfindlichen Kulturpflanzen nach Möglichkeit nicht getroffen werden, während die Wirkstoffe auf die Blätter darunter wachsender unerwünschter Pflanzen oder die unbedeckte Bodenfläche gelangen (post-directed, lay-by).

Die Aufwandmengen an Wirkstoff betragen je nach Bekämpfungsziel, Jahreszeit, Zielpflanzen und Wachstumsstadium 0,001 bis 5, vorzugsweise 0,01 bis 1 kg/ha aktive Substanz (a.S.).

In Anbetracht der Vielseitigkeit der Applikationsmethoden können die erfindungsgemäßen Verbindungen bzw. sie enthaltende Mittel noch in einer weiteren Zahl von Kulturpflanzen zur Beseitigung unerwünschter Pflanzen eingesetzt werden. In Betracht kommen beispielsweise folgende Kulturen:

| | | |
|----|---|-----------------------|
| 15 | Botanischer Name | Deutscher Name |
| | <i>Allium cepa</i> | Küchenzwiebel |
| | <i>Ananas comosus</i> | Ananas |
| | <i>Arachis hypogaea</i> | Erdnuß |
| 20 | <i>Asparagus officinalis</i> | Spargel |
| | <i>Avena sativa</i> | Hafer |
| | <i>Beta vulgaris</i> spp. <i>altissima</i> | Zuckerrübe |
| | <i>Beta vulgaris</i> spp. <i>rapa</i> | Futterrübe |
| 25 | <i>Beta vulgaris</i> spp. <i>esculenta</i> | Rote Rübe |
| | <i>Brassica napus</i> var. <i>napus</i> | Raps |
| | <i>Brassica napus</i> var. <i>napobrassica</i> | Kohlrübe |
| | <i>Brassica napus</i> var. <i>rapa</i> | Weißer Rübe |
| 30 | <i>Brassica rapa</i> var. <i>silvestris</i> | Rüben |
| | <i>Camellia sinensis</i> | Teestrauch |
| | <i>Carthamus tinctorius</i> | Saflor - Färberdistel |
| | <i>Carya illinoensis</i> | Pekannußbaum |
| 35 | <i>Citrus limon</i> | Zitrone |
| | <i>Citrus maxima</i> | Pampelmuse |
| | <i>Citrus reticulata</i> | Mandarine |
| | <i>Citrus sinensis</i> | Apfelsine, Orange |
| 40 | <i>Coffea arabica</i> (<i>Coffea canephora</i> , <i>Coffea liberica</i>) | Kaffee |
| | <i>Cucumis melo</i> | Melone |

45

50

55

| | Botanischer Name | Deutscher Name |
|----|---|----------------------------|
| | <i>Cucumis sativus</i> | Gurke |
| | <i>Cynodon dactylon</i> | Bermudagrass |
| 5 | <i>Daucus carota</i> | Möhre |
| | <i>Elaeis guineensis</i> | Ölpalme |
| | <i>Fragaria vesca</i> | Erdbeere |
| | <i>Glycine max</i> | Sojabohne |
| 10 | <i>Gossypium hirsutum</i> (<i>Gossypium arboreum</i> , <i>Gossypium herbaceum</i> , <i>Gossypium vitifolium</i>) | Baumwolle |
| | <i>Helianthus annuus</i> | Sonnenblume |
| | <i>Helianthus tuberosus</i> | Topinambur |
| 15 | <i>Hevea brasiliensis</i> | Parakautschukbaum |
| | <i>Hordeum vulgare</i> | Gerste |
| | <i>Humulus lupulus</i> | Hopfen |
| | <i>Ipomoea batatas</i> | Süßkartoffeln |
| 20 | <i>Juglans regia</i> | Walnußbaum |
| | <i>Lactuca sativa</i> | Kopfsalat |
| | <i>Lens culinaris</i> | Linse |
| | <i>Linum usitatissimum</i> | Faserlein |
| | <i>Lycopersicon lycopersicum</i> | Tomate |
| 25 | <i>Malus</i> spp. | Apfel |
| | <i>Manihot esculenta</i> | Maniok |
| | <i>Medicago sativa</i> | Luzerne |
| | <i>Mentha piperita</i> | Pfefferminze |
| 30 | <i>Musa</i> spp. | Obst- und Mehlbanane |
| | <i>Nicotiana tabacum</i> (<i>N. rustica</i>) | Tabak |
| | <i>Olea europaea</i> | Ölbaum |
| | <i>Oryza sativa</i> | Reis |
| 35 | <i>Panicum miliaceum</i> | Rispenhirse |
| | <i>Phaseolus lunatus</i> | Mondbohne |
| | <i>Phaseolus mungo</i> | Erdbohne |
| | <i>Phaseolus vulgaris</i> | Buschbohnen |
| 40 | <i>Pennisetum glaucum</i> | Perl- oder Rohrkolbenhirse |
| | <i>Petroselinum crispum</i> spp. <i>tuberosum</i> | Wurzelpetersilie |
| | <i>Picea abies</i> | Rotfichte |
| | <i>Abies alba</i> | Weißtanne |
| 45 | <i>Pinus</i> spp. | Kiefer |
| | <i>Pisum sativum</i> | Gartenerbse |
| | <i>Prunus avium</i> | Süßkirsche |
| | <i>Prunus domestica</i> | Pflaume |
| 50 | <i>Prunus dulcis</i> | Mandelbaum |
| | <i>Prunus persica</i> | Pfirsich |
| | <i>Pyrus communis</i> | Birne |

55

| | Botanischer Name | Deutscher Name |
|----|---|--------------------|
| | <i>Ribes sylvestre</i> | Rote Johannisbeere |
| 5 | <i>Ribes uva-erispa</i> | Stachelbeere |
| | <i>Ricinus communis</i> | Rizinus |
| | <i>Saccharum officinarum</i> | Zuckerrohr |
| | <i>Secale cereale</i> | Roggen |
| 10 | <i>Sesamum indicum</i> | Sesam |
| | <i>Solanum tuberosum</i> | Kartoffel |
| | <i>Sorghum bicolor</i> (s. <i>vulgare</i>) | Mohrenhirse |
| | <i>Sorghum dochna</i> | Zuckerhirse |
| | <i>Spinacia oleracea</i> | Spinat |
| 15 | <i>Theobroma cacao</i> | Kakaobaum |
| | <i>Trifolium pratense</i> | Rotklee |
| | <i>Triticum aestivum</i> | Weizen |
| | <i>Triticum durum</i> | Hartweizen |
| 20 | <i>Vaccinium corymbosum</i> | Kulturheidelbeere |
| | <i>Vaccinium vitis-idaea</i> | Preißelbeere |
| | <i>Vicia faba</i> | Pferdebohnen |
| | <i>Vigna sinensis</i> (<i>V. unguiculata</i>) | Kuhbohne |
| 25 | <i>Vitis vinifera</i> | Weinrebe |
| | <i>Zea mays</i> | Mais |

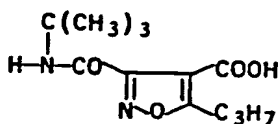
30 Zur Verbreiterung des Wirkungsspektrums und zur Erzielung synergistischer Effekte können die Carbonsäureamide Ia, Ib, Ic und Id mit zahlreichen Vertretern anderer herbizider oder wachstumsregulierenden Wirkstoffgruppen, gemischt und gemeinsam ausgebracht werden. Beispielsweise kommen als Mischungspartner Diazine, 4H-3,1-Benzoxazinderivate, Benzothiadiazinone, 2,6-Dinitroaniline, N-Phenylcarbamate, Thiolcarbamate, Halogencarbonsäuren, Triazine, Amide, Harnstoffe, Diphenylether, Triazinone, Uracile, Benzofuranderivate, Cyclohexan-1,3-dionderivate, Chinolincarbonsäurederivate, Aryloxy-, Heteroaryloxyphenoxypropionsäuren sowie deren Salze, Ester und Amide und andere in Betracht.

35 Außerdem kann es von Nutzen sein, die Verbindungen Ia, Ib, Ic und Id allein oder in Kombination mit anderen Herbiziden auch noch mit weiteren Pflanzenschutzmitteln gemischt gemeinsam auszubringen, beispielsweise mit Mitteln zur Bekämpfung von Schädlingen oder phytopathogenen Pilzen bzw. Bakterien. Von Interesse ist ferner die Mischbarkeit mit Mineralsalzlösungen, welche zur Behebung von Ernährungs- und Spurenelementmängeln eingesetzt werden. Es können auch nichtphytotoxische Öle und Ölkonzentrate zugesetzt werden.

45 Herstellungsbeispiele zur Synthese der Wirkstoffe Ia, Ib, Ic und Id

Beispiel 1

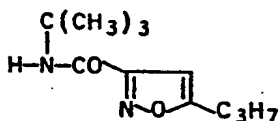
50 3-tert.-Butylaminocarbonyl-5-n-propylisoxazol-4-carbonsäure (Nr. 3.013 in Tabelle 3)



Zu einer Lösung von 10,0 g (47,6 mmol) 5-n-Propyl-isoxazol-3-carbonsäure-tert.-butylamid in 250 ml trockenem Tetrahydrofuran tropfte man unter Stickstoffatmosphäre bei $(-70)^{\circ}\text{C}$ 104,6 mmol n-Butyllithium (67,7 ml einer 1,5 molaren Lösung in Hexan) und rührte 30 min bei dieser Temperatur. Anschließend goß man das Reaktionsgemisch auf 500 g festes CO_2 und ließ über Nacht stehen. Man engte ein, nahm den Rückstand in 300 ml Wasser und 20 ml 2N NaOH auf, extrahierte zweimal mit je 100 ml Diethylether, säuerte die wäßrige Phase mit 6N Salzsäure auf pH 2 an und extrahierte viermal mit je 200 ml Ethylacetat. Man trocknete über Magnesiumsulfat und zog das Solvens im Vakuum ab. Ausbeute: 80 %.

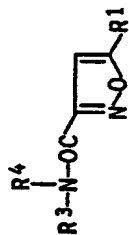
10 Vorstufe 1a

5-n-Propyl-isoxazol-3-carbonsäure-tert.-butylamid



Zu 10,0 g (57,6 mmol) 5-n-Propyl-isoxazol-3-carbonsäurechlorid in 250 ml trockenem Dichlormethan, tropfte man bei 5°C 9,3 g (126,8 mmol) tert.-Butylamin in 20 ml Dichlormethan. Man rührte 12 h bei Raumtemperatur, gab 200 ml Wasser zu, trennte die Phasen, wusch die organische Phase je einmal mit 150 ml gesättigter Natriumhydrogencarbonatlösung und 150 ml gesättigter Natriumchloridlösung, trocknete über Magnesiumsulfat und zog das Solvens im Vakuum ab. Man erhielt 11,5 g (95 %) 5-n-Propyl-isoxazol-3-carbonsäure-tert.-butylamid als Feststoff vom Smp. $34 - 37^{\circ}\text{C}$.

Auf analoge Weise wurden beispielsweise die folgenden Isoxazol-3-carbonsäureamide synthetisiert:



| R ¹ | R ³ | R ⁴ | Fp(°C)/ ¹ H-NMR (250 MHz; CDCl ₃), δ in ppm |
|----------------|----------------|----------------|--|
| Methyl | H | iso-Propyl | 68- 70 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | 79- 82 |
| Methyl | H | Cyclopropyl | 100-105 |
| Methyl | H | Phenyl | 132-135 |
| Methyl | H | Methyl | 122-126 |
| Methyl | H | Ethyl | 61- 67 |
| n-Propyl | H | tert.-Butyl | 34- 37 |
| iso-Propyl | H | tert.-Butyl | 78- 79 |
| iso-Propyl | H | Cyclopropyl | 58- 59 |
| n-Butyl | H | tert.-Butyl | 0, 93 (t;3H), 1, 40 (m;2H), 1, 46 (s;9H), 1, 70 (m;2H), 2, 77 (t;3H), 6, 40 (s,1H), 6, 68 (bs;1H, NH) |
| n-Butyl | H | Cyclopropyl | 58- 61 |
| sek.-Butyl | H | tert.-Butyl | 84- 87 |
| sek.-Butyl | H | Cyclopropyl | 54- 60 |
| tert.-Butyl | H | tert.-Butyl | 132-134 |
| tert.-Butyl | H | Cyclopropyl | 75- 80 |
| Phenyl | H | tert.-Butyl | 131-133 |
| Phenyl | H | Cyclopropyl | 146-147 |

| R ¹ | R ³ | R ⁴ | Fp(°C)/ ¹ H-NMR (250 MHz; CDCl ₃), δ in ppm |
|-----------------------------------|----------------|------------------------------|--|
| 2,4-(Cl,Cl)-Phenyl | H | tert.-Butyl | 1,49 (s;9H), 6,70 (bs;1H,NH), 7,30 (s;1H), 7,25-7,90 (m;3H) |
| Methoxyeth-1-yl | H | tert.-Butyl | 1,48 (s;9H), 1,56 (d;3H), 3,34 (s;3H), 4,52 (q;1H), 6,63 (s;1H), 6,64 (bs;1H,NH) |
| Methoxyeth-1-yl | H | Cyclopropyl | 0,60-0,93 (m;4H), 1,54 (d;3H), 2,91 (m;1H), 3,38 (s;3H), 4,54 (q;1H), 6,68 (s;1H), 7,04 (bs;1H,NH) |
| Methoxyeth-1-yl | H | sek.-Butyl | 37-40 |
| Methoxyeth-1-yl | H | Cyclopropyl-methyl | 0,24-0,60 (m;4H), 1,09 (m;1H), 1,56 (d;3H), 3,34 (m;2H), 3,38 (s;3H), 4,58 (q;1H), 6,70 (s;1H), 7,30 (bs;1H,NH) |
| Methoxymethyl | H | tert.-Butyl | 1,46 (s;9H), 3,44 (s;3H), 4,60 (s;2H), 6,68 (s;1H), 6,68 (bs;1H,NH) |
| Methoxymethyl | H | sek.-Butyl | 0,96 (t;3H), 1,26 (d;3H), 1,58 (m;2H), 3,43 (s;3H), 4,10 (m;1H), 4,56 (s;2H), 6,70 (bs;1H,NH), 6,74 (s;1H) |
| 2-Methyltetrahydro- pyran-2-yl | H | Cyclopropyl | 60-62 |
| 2-Methyltetrahydro- pyran-2-yl | H | 3-CF ₃ -Phenyl | 1,54 (s;3H), 1,40-2,46 (m;6H), 3,56 (m;2H), 6,74 (s;1H), 6,75-8,00 (m;4H), 8,68 (bs;1H,NH) |
| 2-Methyl-norbornan-2-yl* | H | Cyclopropyl | 0,60-0,94 (m;4H), 1,18-2,42 (m;13H), 2,90 (m;1H), 6,42 (s;1H), 6,97 (bs;1H,NH) |
| 4-F-Phenyl | H | tert.-Butyl | 115-118 |
| 2,4,6-Trimethylphenyl | H | tert.-Butyl | 83-90 |
| Cyclopropyl | H | neo-Pentyl | 85-90 |
| Cyclopropyl | H | 1,1-Dimethyl- -2-propenyl | 48-54 |
| Cyclopropyl | H | Benzyl | 89-93 |

* Isomerengemisch: exo:endo 1:1

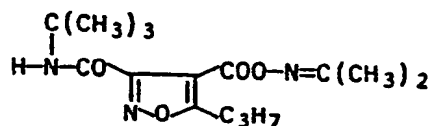
| R ¹ | R ³ | R ⁴ | Fp(°C)/ ¹ H-NMR (250 MHz; CDCl ₃), δ in ppm |
|-------------------------------|----------------|----------------------|--|
| Cyclopropyl | H | 2-Methoxyethyl | 0, 92-1, 14 (m; 4H), 2, 09 (m; 1H), 3, 37 (s; 1H), 3, 58 (m; 4H), 6, 33 (s; 1H), 7, 11 (bs; 1H, NH) |
| Cyclopropyl | H | 2-Propenyl | 42- 46 |
| Cyclopropyl | H | Cyclopentyl | 86- 92 |
| Cyclohexyl | H | tert.-Butyl | 98-100 |
| Cyclohexyl | H | Cyclopropyl | 134-136 |
| Cyclohexyl | H | 1-Cyclopropyl-ethyl | 117-122 |
| Cyclopropyl | H | tert.-Butyl | 80- 84 |
| Cyclopropyl | H | Cyclopropyl | 92- 98 |
| Cyclopropyl | H | 1-Cyclopropyl-ethyl | 60- 64 |
| 1-Methylcyclohexyl | H | tert.-Butyl | 84- 87 |
| 1-Methylcyclohexyl | H | Cyclopropyl | 0, 60-0, 91 (m; 4H), 1, 27 (s; 3H), 1, 29-2, 10 (m; 10H), 2, 86 (m; 1H), 6, 47 (s; 1H), 6, 92 (bs; 1H, NH) |
| Cyclopropyl | H | sek.-Butyl | 70- 77 |
| Cyclopropyl | H | Cyclopropyl-methyl | 62- 66 |
| Methyl | H | 1-Cyclopropyl-ethyl | 75 |
| Cyclopropyl | H | Cyclohexyl | 133-136 |
| 2-Methyltetrahydro-pyran-2-yl | H | tert.-Butyl | 72- 76 |
| Methyl | H | Cyclobutyl | 100-103 |
| Methyl | H | 1, 1-Dimethyl-propyl | 0, 91 (t; 3H), 1, 41 (s; 6H), 1, 83 (q; 2H), 2, 48 (s; 3H), 6, 40 (s; 1H), 6, 56 (bs; 1H, NH) |
| Methyl | H | neo-Pentyl | 108-111 |

5
10
15
20
25
30
35
40
45
50
55

| R ¹ | R ³ | R ⁴ | Fp(°C)/ ¹ H-NMR (250 MHz; CDCl ₃), δ in ppm |
|----------------|----------------|-------------------------|---|
| 2-Furanyl | H | tert.-Butyl | 65- 70 |
| 2-Furanyl | H | Cyclopropyl | 152-153 |
| Methyl | H | sek.-Butyl | 79- 84 |
| Methyl | H | 2-Methoxy-ethyl | 2,48 (s;3H), 3,37 (s;3H), 3,57 (m;4H), 6,44 (s;1H), 7,17 (bs;1H,NH), 5,14 (m;2H), 6,09 (m;1H), 6,40 (s;1H), 6,77 (bs;1H,NH) |
| Methyl | H | 1,1-Dimethyl-2-propenyl | 1,54 (s;6H), 2,47 (s;3H) |
| Methyl | H | Cyclopentyl | 93- 97 |

Beispiel 2

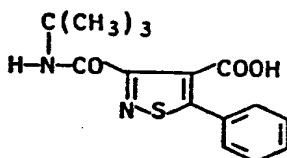
3-tert.-Butylaminocarbonyl-5-n-propyl-isoxazol-4-carbonsäure-acetonoximester (Nr. 3.014 in Tabelle 3)



Zu einer Lösung von 3,3 g (13,0 mmol) 3-tert.-Butylaminocarbonyl-5-n-propyl-isoxazol-4-carbonsäure (hergestellt nach Beispiel 1) und 1,2 g (16,9 mmol) Acetonoxim in 100 ml Dichlormethan tropfte man bei Raumtemperatur 4,9 g (48,1 mmol) 4-Methylmorpholin sowie 1,6 g (13,0 mmol) 4-Dimethylaminopyridin und rührte 5 min. Anschließend fügte man 11,3 g einer 50 %igen Lösung von Propanphosphonsäureanhydrid in Dichlormethan (= 17,8 mmol) zu und erhitze 12 h unter Rückfluß. Man engte ein, nahm den Rückstand in 100 ml Ethylacetat auf, extrahierte zweimal mit gesättigter Natriumhydrogencarbonatlösung sowie je einmal mit 5 %iger Zitronensäurelösung, gesättigter Natriumcarbonatlösung und gesättigter Natriumchloridlösung. Die organische Phase wurde über Magnesiumsulfat getrocknet und das Solvens im Vakuum abgezogen. Ausbeute: 95 %.

Beispiel 3

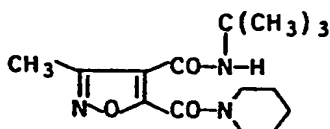
3-tert.-Butylaminocarbonyl-5-phenyl-isothiazol-4-carbonsäure (Nr. 3.045 in Tabelle 3)



Zu 2,0 g (8,7 mmol) 5-Phenyl-isothiazol-3,4-dicarbonsäureanhydrid in 10 ml Dichlormethan tropfte man unter Eiskühlung 0,64 g (8,8 mmol) tert.-Butylamin und rührte 3 h bei Raumtemperatur. Danach engte man die Lösung ein, versetzte mit 25 ml Wasser, säuerte mit 6N HCl auf pH 2 an und extrahierte dreimal mit je 30 ml Ethylacetat. Die organische Phase wurde mit 20 ml gesättigter Natriumchloridlösung gewaschen, über Magnesiumsulfat getrocknet und eingengt. Der Rückstand wurde an Kieselgel (Lösungsmittel: Ethanol/Toluol 2:3) chromatographiert. Ausbeute: 49 %.

Beispiel 4

5-Piperidinocarbonyl-3-methyl-isoxazol-4-carbonsäure-tert.-butylamid (Nr. 5.001 in Tabelle 5)



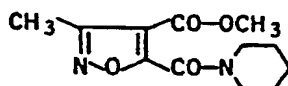
5

Zu 4,6 g (19,3 mmol) 5-Piperidinocarbonyl-3-methyl-isoxazol-4-carbonsäure in 100 ml Dichlormethan tropfte man bei (-5) °C nacheinander 1,8 g (25,1 mmol) tert.-Butylamin, 7,2 g (71,6 mmol) Methylmorpholin, 0,8 g (6,4 mmol) Dimethylaminopyridin und 16,8 g einer 50 %igen Lösung von Propanphosphonsäureanhydrid in Dichlormethan (= 26,4 mmol) und rührte 12 h bei Raumtemperatur. Man zog das Solvens im Vakuum ab, nahm den Rückstand in 200 ml Ethylacetat auf und extrahierte zweimal mit gesättigter Natriumhydrogencarbonatlösung sowie je einmal mit 5 %iger Zitronensäurelösung, gesättigter Natriumcarbonatlösung und gesättigter Natriumchloridlösung. Die organische Phase wurde über Magnesiumsulfat getrocknet und das Solvens im Vakuum abgezogen. Ausbeute: 90 %.

Vorstufe 4α

20

5-Piperidinocarbonyl-3-methyl-isoxazol-4-carbonsäuremethylester



25

Zu 5,0 g (27,0 mmol) 4-Methoxycarbonyl-3-methyl-isoxazol-5-carbonsäure in 100 ml Dichlormethan tropfte man bei (-5) °C nacheinander 3,0 g (35,1 mmol) Piperidin, 10,1 g (100,0 mmol) Methylmorpholin, 1,1 g (9 mmol) Dimethylaminopyridin und 22,9 g einer 50 %igen Lösung von Propanphosphonsäureanhydrid in Dichlormethan (36,0 mmol) und rührte 12 h bei Raumtemperatur. Man zog das Solvens im Vakuum ab, nahm den Rückstand in 200 ml Ethylacetat auf und extrahierte zweimal mit gesättigter Natriumhydrogencarbonatlösung sowie je einmal mit 5 %iger Zitronensäurelösung und gesättigter Natriumchloridlösung. Die organische Phase wurde über Magnesiumsulfat getrocknet und das Solvens im Vakuum abgezogen. Ausbeute: 90 %; ¹H-NMR (250 MHz; CDCl₃): δ = 1,65 ppm (m; 6H), 2,49 ppm (s; 3H), 3,18 ppm (m; 2H), 3,73 ppm (m; 2H), 3,87 ppm (s; 3H).

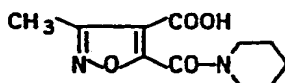
35

Vorstufe 4β

40

5-Piperidinocarbonyl-3-methyl-isoxazol-4-carbonsäure

45



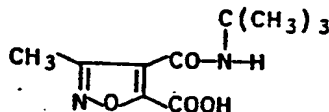
50

Zu einer Lösung von 5,7 g (22,6 mmol) 5-Piperidinocarbonyl-3-methyl-isoxazol-4-carbonsäuremethylester in 20 ml Methanol tropfte man unter N₂ bei (-15) bis (-10) °C innerhalb von 4 h 1,0 g (25,0 mmol) Natriumhydroxid in 20 ml Wasser und rührte 12 h bei Raumtemperatur. Man engte die Lösung ein, nahm den Rückstand in 100 ml Wasser auf, stellte auf pH 8 - 9 ein und extrahierte einmal mit 100 ml Diethylether. Anschließend säuerte man mit 6N HCl auf pH 2 an und extrahierte viermal mit je 100 ml Dichlormethan. Die vereinigten organischen Phasen wurden über Magnesiumsulfat getrocknet und das Solvens im Vakuum abgezogen. Ausbeute: 91 %; Smp.: 128 - 130 °C.

55

Beispiel 5

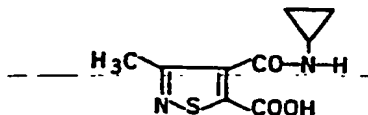
4-tert.-Butylaminocarbonyl-3-methyl-isoxazol-5-carbonsäure (Nr. 4.001 in Tabelle 4)



Zu 3,3 g (11,3 mmol) 5-Piperidinocarbonyl-3-methyl-isoxazol-4-carbonsäure-tert.-butylamid (hergestellt nach Beispiel 4) in 150 ml Diethylether und 0,4 g (22,2 mmol) Wasser gab man portionsweise 7,6 g (67,8 mmol) Kalium-tert.-butylat und rührte 6 h bei Raumtemperatur. Nach Zugabe von 50 ml Wasser und Phasentrennung wurde die wäßrige Phase mit 6N HCl auf pH 2 angesäuert und viermal mit je 100 ml Ethylacetat extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen wurden wie üblich auf das Produkt hin aufgearbeitet. Das Rohprodukt wurde aus Cyclohexan/Ethylacetat 5 : 1 umkristallisiert. Ausbeute: 42 %; farblose Kristalle.

Beispiel 6

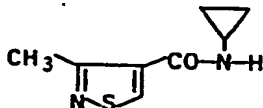
4-Cyclopropylamino-3-methyl-isothiazol-5-carbonsäure (Nr. 4.006 in Tabelle 4)



Zu einer Lösung von 5,2 g (28,6 mmol) 3-Methyl-isothiazol-4-carbonsäurecyclopropylamid in 250 ml Tetrahydrofuran tropfte man unter Stickstoffatmosphäre bei -70 °C 60,0 mmol n-Butyllithium (40,0 ml einer 1,5 molaren Lösung in Hexan) und rührte 30 min bei dieser Temperatur. Anschließend goß man das Reaktionsgemisch auf 500 g festes CO₂ und ließ über Nacht stehen. Man engte ein, nahm den Rückstand in 300 ml Wasser und 15 ml 2N NaOH auf, extrahierte zweimal mit je 100 ml Diethylether, säuerte die wäßrige Phase mit 6N Salzsäure auf pH 2 an und extrahierte viermal mit je 200 ml Ethylacetat. Man trocknete über Magnesiumsulfat und zog das Solvens im Vakuum ab. Ausbeute: 74 %.

Vorstufe 6a

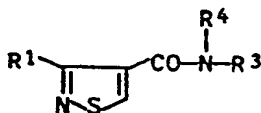
3-Methyl-isothiazol-4-carbonsäure-cyclopropylamid



Zu 7,2 g (50,0 mmol) 3-Methyl-isothiazol-4-carbonsäure in 200 ml Dichlormethan tropfte man bei -5 °C nacheinander 3,7 g (65,0 mmol) Cyclopropylamin, 18,7 g (185,0 mmol) Methylmorpholin, 2,0 g (16,7 mmol) Dimethylaminopyridin und 43,5 g einer 50 %igen Lösung von Propanphosphonsäureanhydrid in Dichlormethan (= 68,4 mmol) und rührte 12 h bei Raumtemperatur. Man zog das Solvens im Vakuum ab, nahm den Rückstand in 250 ml Ethylacetat auf und extrahierte zweimal mit gesättigter Natriumhydrogencarbonatlösung.

sung sowie je einmal mit 5 %iger Zitronensäurelösung, gesättigter Natriumcarbonatlösung und gesättigter Natriumchloridlösung. Die organische Phase wurde über Magnesiumsulfat getrocknet und das Solvens im Vakuum abgezogen. Ausbeute: 84 %; Smp.: 106 - 108 °C.

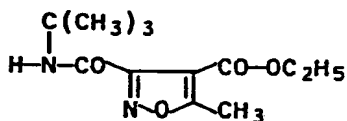
Auf analoge Weise wurden beispielsweise die folgenden Isothiazol-4-carbonsäureamide synthetisiert:



| R1 | R3 | R4 | Fp (°C) |
|------------|----|---------------------------|---------|
| Methyl | H | Cyclopropyl | 106-108 |
| Methyl | H | tert.-Butyl | 96- 97 |
| Methyl | H | iso-Propyl | 100-102 |
| iso-Propyl | H | 3-CF ₃ -Phenyl | 114-115 |
| iso-Propyl | H | tert.-Butyl | 158-159 |
| Phenyl | H | Cyclopropyl | 172-173 |
| Phenyl | H | 4-Cl-Phenyl | 202-203 |

Beispiel 7

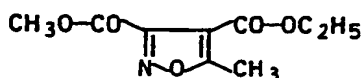
4-Ethoxy-carbonyl-5-methyl-isoxazol-3-carbonsäure-tert.-butylamid (Nr. 3.036 in Tabelle 3)



Zu 10,6 g (53,3 mmol) 4-Ethoxycarbonyl-5-methyl-isoxazol-3-carbonsäure in 150 ml Toluol und 2 ml Dimethylformamid tropfte man bei Raumtemperatur 12,7 g (106,8 mmol) Thionylchlorid und rührte 1 h bei 80 °C. Man zog die Solventien im Vakuum ab, löste den Rückstand in 200 ml trockenem Dichlormethan und tropfte 10,0 g (137,0 mmol) tert.-Butylamin in 20 ml trockenem Dichlormethan zu. Man rührte 12 h bei Raumtemperatur, gab 200 ml Wasser zu, trennte die Phasen, wusch die organische Phase je einmal mit 150 ml gesättigter Natriumhydrogencarbonatlösung und 150 ml gesättigter Natriumchloridlösung, trocknete über Magnesiumsulfat und zog das Solvens im Vakuum ab. Ausbeute: 73 %.

Vorstufe 7a

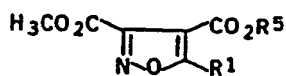
4-Ethoxycarbonyl-5-methyl-isoxazol-3-carbonsäuremethylester



Zu 9,9 g (0,33 mol) NaH (80 %ige Suspension in Weißöl) in 1 l trockenem Toluol tropfte man bei

Raumtemperatur 39,0 g (0,3 mol) Acetessigsäureethylester in 100 ml Toluol und rührte 3 h. Anschließend gab man 41,3 g (0,3 mol) Methyl- α -chloro- α -oximinoacetat in 100 ml Toluol zu und rührte 12 h bei Raumtemperatur. Danach überführte man das Reaktionsgemisch in eine Soxhletapparatur (Extraktionshülse gefüllt mit Molekularsieb 4 Å), fügte 1 g Methansulfonsäure hinzu und erhitze 1,5 h unter Rückfluß. Man ließ abkühlen, wusch die organische Phase je einmal mit 200 ml Dinatriumhydrogenphosphatlösung und 200 ml gesättigter Natriumchloridlösung, trocknete über Magnesiumsulfat und zog das Solvens im Vakuum ab. Ausbeute: 63 %; gelbes Öl; $^1\text{H-NMR}$ (250 MHz; CDCl_3): δ = 1,34 ppm (t; 3H), 2,73 ppm (s; 3H), 4,00 ppm (s; 3H), 4,32 ppm (q; 2H).

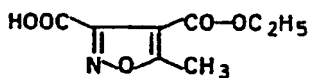
Auf analoge Weise wurden beispielsweise die folgenden Isoxazolidicarbonsäurediester synthetisiert:



| R ¹ | R ⁵ | $^1\text{H-NMR}$ (250 MHz; CDCl_3) δ in ppm |
|------------------------------------|----------------------------------|--|
| CH ₃ | CH ₃ | 2,72 (s;3H), 3,87 (s;3H), 4,00 (s;3H) |
| CH ₃ | C(CH ₃) ₃ | 1,52 (s;9H), 2,70 (s;3H), 4,00 (s;3H) |
| CH ₃ | C ₂ H ₅ | 1,34 (t;3H), 2,73 (s;3H), 4,00 (s;3H), 4,32 (q;2H) |
| CF ₃ | C ₂ H ₅ | 1,39 (t;3H), 4,06 (s;3H), 4,42 (q;2H) |
| (CH ₃) ₂ CH | C ₂ H ₅ | 1,34 (t;3H), 1,37 (d;6H), 3,73 (sp;1H), 4,00 (s;3H), 4,29 (q;2H) |

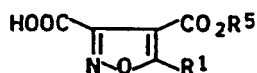
Vorstufe 7 β

4-Ethoxycarbonyl-5-methyl-isoxazol-3-carbonsäure



Zu 25,0 g (0,117 mol) 4-Ethoxycarbonyl-5-methyl-isoxazol-3-carbonsäuremethylester in 200 ml trockenem Tetrahydrofuran tropfte man unter N₂-Atmosphäre bei -15 bis -10 °C 4,7 g (0,117 mol) Natriumhydroxid in 80 ml Wasser und rührte 12 h. Man zog die Solventien am Rotationsverdampfer ab (Badtemperatur 30 - 35 °C), nahm den Rückstand in 250 ml Wasser auf, stellte mit Salzsäure auf pH = 8 - 9 ein und extrahierte zweimal mit je 150 ml Diethylether. Anschließend säuerte man die wäßrige Phase mit 6N HCl auf pH = 2 an und extrahierte viermal mit je 250 ml Ethylacetat. Die vereinigten organischen Phasen wurden über Magnesiumsulfat getrocknet und das Solvens im Vakuum abgezogen. Ausbeute: 70 %; $^1\text{H-NMR}$ (250 MHz; CDCl_3): δ = 1,42 ppm (t; 3H), 2,80 ppm (s; 3H), 4,59 ppm (q; 2H).

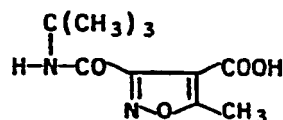
Auf analoge Weise wurden beispielsweise die folgenden Isoxazol-3-carbonsäuren synthetisiert:



| 5 | R ¹ | R ⁵ | ¹ H-NMR (250 MHz; CDCl ₃) δ in ppm |
|----|-----------------|----------------------------------|--|
| | CH ₃ | C ₂ H ₅ | 1,42 (t;3H), 2,80 (s;3H), 4,59 (q;2H) |
| 10 | CH ₃ | C(CH ₃) ₃ | 1,54 (s;9H), 2,34 (s;3H), 13,80 (bs;1H) |
| | CF ₃ | C ₂ H ₅ | 1,29 (t;3H), 4,15 (q;2H) |

Beispiel 8

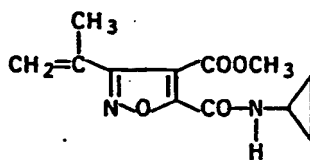
3-tert.-Butylaminocarbonyl-5-methyl-isoxazol-4-carbonsäure (Nr. 3.002 in Tabelle 3)



Zu einer Lösung von 5,4 g (21,3 mmol) 4-Ethoxycarbonyl-5-methyl-isoxazol-3-carbonsäure-tert.-butylamid in 100 ml Ethanol tropfte man unter N₂ bei 5 bis 10 °C 1,0 g (25,0 mmol) Natriumhydroxid in 50 ml Wasser und rührte 12 h bei Raumtemperatur. Man engte die Lösung ein, nahm den Rückstand in 150 ml Wasser auf, stellte auf pH = 8 - 9 ein und extrahierte zweimal mit je 100 ml Diethylether. Danach säuerte man die wäßrige Phase mit 6N HCl auf pH = 2 an und extrahierte viermal mit je 200 ml Ethylacetat. Die vereinigten organischen Phasen wurden über Magnesiumsulfat getrocknet und das Solvens im Vakuum abgezogen. Ausbeute: 95 %; gelber Farbstoff.

Beispiel 9

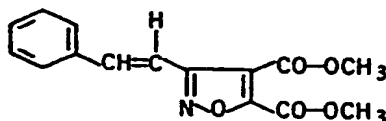
5-Cyclopropylaminocarbonyl-3-isopropenyl-isoxazol-4-carbonsäuremethylester (Nr. 6.02 in Tabelle 6)



Zu einer Lösung von 9,0 g (0,043 mol) 3-Isopropenyl-4-methoxycarbonyl-isoxazol-5-carbonsäure in 200 ml Dichlormethan wurden bei 5 °C nacheinander 3,1 g (0,055 mol) Cyclopropylamin, 16,0 g (0,158 mol) 4-Methylmorpholin, 1,73 g (0,014 mol) 4-Dimethylaminopyridin und 37,0 g (0,058 mol) einer 50 %igen Lösung aus Propanphosphonsäureanhydrid in Dichlormethan getropft. Nach 12-stündigem Rühren bei Raumtemperatur wurde das Lösungsmittel entfernt, der Rückstand in 250 ml Ethylacetat aufgenommen, zweimal mit gesättigter Natriumhydrogencarbonatlösung und je einmal mit 5 %iger Zitronensäurelösung, gesättigter Natriumcarbonat- und Natriumchloridlösung extrahiert. Nach Trocknen über Magnesiumsulfat wurde das Solvens bei reduziertem Druck abdestilliert. Ausbeute: 54 %.

Vorstufe 9 α

E-3-Styryl-isoxazol-4,5-dicarbonsäuredimethylester

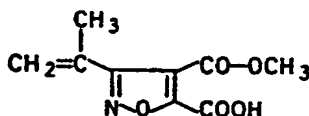


Eine auf 0 °C gekühlte Mischung aus 14,7 g (0,1 mol) E-Zimtaldehydoxim, 1,8 g (0,01 mol) Dinatriumhydrogenphosphat-Dihydrat, 1,6 g (0,01 mol) Natriumdihydrogenphosphat-Dihydrat, 50 ml Dichlormethan und 50 ml Wasser, wurde mit Salzsäure/Natronlauge auf pH=6,3 eingestellt. Nach Zugabe von 14,2 g (0,1 mol) Acetylendicarbonsäuredimethylester wurden innerhalb einer Stunde bei 0-10 °C 61,2 g (0,11 mol) einer 13,4 %igen wäßrigen Natriumhypochlorid-Lösung zugetropft und gleichzeitig der pH-Wert durch Zugabe von Salzsäure oder Natronlauge konstant gehalten. Anschließend wurde 1 Std. bei Raumtemperatur nachgerührt, die Phasen getrennt und die wäßrige Phase zweimal mit je 100 ml Dichlormethan extrahiert. Nach Trocknen der vereinigten organischen Phasen über Natriumsulfat wurde das Lösungsmittel im Vakuum entfernt und die leichter flüchtigen Komponenten bei 120 °C (0,1 Torr) abdestilliert. Ausbeute: 56 %; ¹H-NMR (in CDCl₃): δ = 3,9 ppm (s; 3H), 4,0 ppm (s; 3H), 7,2 ppm (d; 1H), 7,3-7,7 ppm (m; 6H).

Analog Vorstufe 9 α wurde auch der 3-Isopropenyl-isoxazol-4,5-dicarbonsäuredimethylester synthetisiert. Ausbeute: 26 %; ¹H-NMR (in CDCl₃): δ = 2,2 ppm (s; 3H), 3,9 ppm (s; 3H), 4,0 ppm (s; 3H), 5,45 ppm (m; 2H).

Vorstufe 9 β

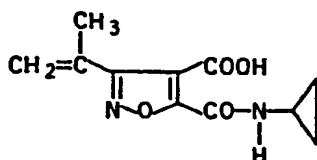
3-Isopropenyl-4-methoxycarbonyl-isoxazol-5-carbonsäure



Zu 20,0 g (0,09 mol) 3-Isopropenylisoxazol-4,5-dicarbonsäuredimethylester (aus Stufe A.1) in 150 ml Methanol wurde bei 0 °C eine Lösung aus 3,6 g (0,09 mol) Natriumhydroxid in 75 ml Wasser getropft und anschließend 14 Std. bei Raumtemperatur gerührt. Nach Zugabe von 250 ml Wasser wurde auf pH=8 eingestellt, mit 200 ml Dichlormethan extrahiert, die wäßrige Phase mit 6N-Salzsäure auf pH=1-2 eingestellt und dreimal mit je 250 ml Dichlormethan extrahiert. Die vereinigten organischen Extrakte wurden über Magnesiumsulfat getrocknet und das Lösungsmittel unter Vakuum abdestilliert. Ausbeute: 97 %; ¹H-NMR (in CDCl₃): δ = 2,12 ppm (s; 3H), 4,07 ppm (s; 3H), 5,41 ppm (m; 2H); 8,00 ppm (bs; 1H).

Beispiel 10

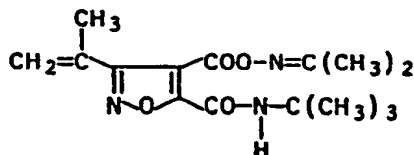
5- Cyclopropylaminocarbonyl-3-isopropenyl-isoxazol-4-carbonsäure (Nr. 6.05 in Tabelle 6)



Zu einer Lösung von 4,0 g (0,016 mol) 5-Cyclopropylaminocarbonyl-3-isopropenyl-4-carbonsäuremethylester (hergestellt nach Beispiel 9) in 50 ml Methanol wurden bei 5 bis 10°C 0,68 g (0,017 mol) Natriumhydroxid gegeben. Nach 12-stündigem Rühren bei Raumtemperatur wurde das Lösungsmittel entfernt, der Rückstand in 150 ml Wasser aufgenommen, die Mischung auf pH=8-9 eingestellt und zweimal mit je 100 ml Diethylether extrahiert. Danach säuerte man die wäßrige Phase mit 6N HCl auf pH=2 an, extrahierte viermal mit je 200 ml Ethylacetat, trocknete die vereinigten organischen Phasen über Magnesiumsulfat und destillierte das Lösungsmittel bei reduziertem Druck ab. Ausbeute: 74 %.

Beispiel 11

5-tert.-Butylaminocarbonyl-3-isopropenyl-isoxazol-4-carbonsäureacetonoximester (Nr. 6.08 in Tabelle 6)



Zu einer Lösung von 4,0 g (0,016 mol) 5-tert.-Butylaminocarbonyl-3-isopropenyl-isoxazol-4-carbonsäure (Nr. 6.06 in Tabelle 6) und 1,5 g (0,021 mol) Acetonoxim in 200 ml Dichlormethan wurden bei Raumtemperatur 5,9 g (0,059 mol) 4-Methylmorpholin und 1,94 g (0,016 mol) 4-Dimethylaminopyridin getropft und nach 5-minütigem Rühren 13,7 g (0,0215 mol) einer 50 %igen Lösung von Propanphosphonsäureanhydrid in Dichlormethan zugegeben. Nach 8-stündigem Erhitzen auf Rückflußtemperatur wurde das Lösungsmittel entfernt, der Rückstand in 100 ml Ethylacetat gelöst und analog Beispiel 9 auf das Produkt hin aufgearbeitet. Ausbeute: 55%.

Die physikalischen Daten der Endprodukte (Beispiele 1 bis 10) sind den folgenden Tabellen 3 bis 7 zu entnehmen, in denen noch weitere Verbindungen Ia, Ib, Ic und Id aufgeführt sind, welche auf die gleichen Weisen hergestellt wurden oder herstellbar sind.

Tabelle 3



Ia (R2 = CO-YR5)

| Nr. | R1 | R3 | R4 | R5 | X | Y | Fp. [°C]/ ¹ H-NMR (250 MHz, CDCl ₃), δ in ppm |
|-------|----------|----|--------------|---|---|---|---|
| 3.001 | Methyl | H | iso-Propyl | H | 0 | 0 | 134-137 |
| 3.002 | Methyl | H | tert.-Butyl | H | 0 | 0 | 90-93 |
| 3.003 | Methyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 | 0 | 120-125 |
| 3.004 | Methyl | H | Phenyl | H | 0 | 0 | 178-181 |
| 3.005 | Methyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | 0 | 110-113 |
| 3.006 | Methyl | H | tert.-Butyl | Succinimido | 0 | 0 | 172-178 |
| 3.007 | Methyl | H | cyclo-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | 0 | 160-163 |
| 3.008 | Methyl | H | Methyl | H | 0 | 0 | 180-184 |
| 3.009 | Methyl | H | Ethyl | H | 0 | 0 | 130-134 |
| 3.010 | Methyl | H | tert.-Butyl | 2,4-Cl, Cl-Phenyl | 0 | 0 | 134-137 |
| 3.011 | Methyl | H | tert.-Butyl | 2,3-OCH ₃ , OCH ₃ -Phenyl | 0 | 0 | 170-173 |
| 3.012 | Methyl | H | tert.-Butyl | 4-OCH ₃ -Phenyl | 0 | 0 | 141-143 |
| 3.013 | n-Propyl | H | tert.-Butyl | H | 0 | 0 | 1.00 (t; 3H), 1.52 (s; 9H), 1.80 (m; 2H), 3.25 (t; 2H), 7.17 (bs; 1H, NH) |

Tabelle 3 (Fortsetzung)

| Nr. | R ¹ | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | X | Y | Fp. [°C]/ ¹ H-NMR (250 MHz, CDCl ₃), δ in ppm |
|-------|----------------|----------------|----------------|-------------------------------------|---|---|--|
| 3.014 | n-Propyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | 0 | 95-96 |
| 3.015 | n-Propyl | H | tert.-Butyl | Propargyl | 0 | 0 | 60-66 |
| 3.016 | iso-Propyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 | 0 | 70-71 |
| 3.017 | iso-Propyl | H | cyclo-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | 0 | 105-107 |
| 3.018 | iso-Propyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | 0 | 139-143 |
| 3.019 | iso-Propyl | H | tert.-Butyl | H | 0 | 0 | 32-35 |
| 3.020 | n-Butyl | H | tert.-Butyl | H | 0 | 0 | 0,94 (t; 3H), 1,41 (m; 2H), 1,49 (s; 9H), 1,74 (m; 2H), 3,27 (t; 2H), 7,25 (bs; 1H, NH) |
| 3.021 | n-Butyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 | 0 | 74-77 |
| 3.022 | n-Butyl | H | cyclo-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | 0 | 62-67 |
| 3.023 | tert.-Butyl | H | tert.-Butyl | H | 0 | 0 | 95-99 |
| 3.024 | tert.-Butyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | 0 | 101-104 |
| 3.025 | tert.-Butyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 | 0 | 70-72 |
| 3.026 | tert.-Butyl | H | cyclo-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | 0 | 122-125 |
| 3.027 | sek.-Butyl | H | tert.-Butyl | H | 0 | 0 | 40 |
| 3.028 | sek.-Butyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 | 0 | 0,80 (m; 2H), 0,92 (m; 2H), 0,90 (t; 3H), 1,30 (d; 3H), 1,77 (m; 2H), 3,00 (m; 1H), 4,00 (m; 1H), 7,83 (bs; 1H, NH) |
| 3.029 | sek.-Butyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | 0 | 97-101 |

Tabelle 3 (Fortsetzung)



| Nr. | R1 | R3 | R4 | R5 | X | Y | Fp. [°C]/ ¹ H-NMR (250 MHz, CDCl ₃), δ in ppm |
|-------|-----------------------|----|--------------|--|---|---|---|
| 3.030 | sek.-Butyl | H | cyclo-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | 0 | 0,66 (m; 2H), 0,89 (m; 2H), 0,90 (t; 3H), 1,36 (d; 3H), 1,72 (m; 2H), 2,08 und 2,09 (2s; 6H), 2,92 (m; 1H), 3,58 (m; 1H), 7,25 (bs; 1H, NH) |
| 3.031 | Phenyl | H | tert.-Butyl | H | 0 | 0 | 133-135 |
| 3.032 | Phenyl | H | cyclo-Propyl | H | 0 | 0 | 144-146 |
| 3.033 | Phenyl | H | cyclo-Propyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | 0 | 153-155 |
| 3.034 | Phenyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | 0 | 131 |
| 3.035 | 2,4-Cl, Cl- Phenyl | H | tert.-Butyl | H | 0 | 0 | 1,54 (s; 9H), 7,25 (bs; 1H, NH), 7,20-7,90 (m; 3H) |
| 3.036 | Methyl | H | tert.-Butyl | Ethyl | 0 | 0 | 1,40 (t; 3H), 1,48 (s; 9H), 2,70 (s; 3H), 4,37 (q; 2H), 7,89 (bs; 1H, NH) |
| 3.037 | Iso-Propyl | H | tert.-Butyl | -N=C(C ₂ H ₅)(CH ₃) | 0 | 0 | 107-112 |
| 3.038 | Iso-Propyl | H | tert.-Butyl |  | 0 | 0 | 137-141 |
| 3.039 | Iso-Propyl | H | tert.-Butyl |  | 0 | 0 | 114-117 |

Tabelle 3 (Fortsetzung)

| Nr. | R ¹ | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | X | Y | Fp. [°C]/ ¹ H-NMR (250 MHz, CDCl_3), δ in ppm |
|-------|------------------------|----------------|----------------|---|---|---|--|
| 3.040 | Iso-Propyl | H | tert.-Butyl | $\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}-\text{C}_6\text{H}_5$ | 0 | 0 | 1,38 (d; 6H), 1,44 (s; 9H), 3,72 (sp; 1H), 4,94 (m; 2H), 6,20-6,90 (m; 2H), 7,22-7,40 (m; 5H) |
| 3.041 | Iso-Propyl | H | tert.-Butyl | CH_2CCl_3 | 0 | 0 | 68-71 |
| 3.042 | Iso-Propyl | H | tert.-Butyl | $\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CN}$ | 0 | 0 | 93-95 |
| 3.043 | Iso-Propyl | H | tert.-Butyl | CH_2CF_3 | 0 | 0 | 73-76 |
| 3.044 | Iso-Propyl | H | tert.-Butyl | 3-Jod-propargyl | 0 | 0 | 1,38 (d; 6H), 1,44 (s; 9H), 3,70 (sp; 1H), 4,40 (s; 2H), 6,70 (bs; 1H, NH) |
| 3.045 | Phenyl | H | tert.-Butyl | H | S | 0 | > 190 (Zers.) |
| 3.046 | Iso-Propyl | H | tert.-Butyl | Methyl | 0 | 0 | 123-124 |
| 3.047 | 1-Methoxy- eth-1-yl | H | tert.-Butyl | H | 0 | 0 | 1,55 (d; 3H); 1,55 (s; 9H); 3,35 (s; 3H); 5,46 (q; 1H); 7,30 (bs; 1H, NH) |
| 3.048 | 1-Methoxy- eth-1-yl | H | Cyclopropyl | H | 0 | 0 | 97-98 |
| 3.049 | 1-Methoxy- eth-1-yl | H | sek.-Butyl | H | 0 | 0 | 83-87 |

Tabelle 3 (Fortsetzung)

| Nr. | R ¹ | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | X | Y | Fp. [°C]/ ¹ H-NMR (250 MHz, CDCl ₃), δ in ppm |
|-------|--------------------|----------------|--------------------|-------------------------------------|---|---|---|
| 3.050 | 1-Methoxy-eth-1-yl | H | Cyclopropyl-methyl | H | 0 | 0 | 0,38 (m; 2H); 0,63 (m; 2H); 1,10 (m; 1H); 1,57 (d; 3H); 3,38 (s; 3H); 3,40 (m; 2H); 5,46 (q; 1H); 7,64 (bs, 1H, NH) |
| 3.051 | 1-Methoxy-eth-1-yl | H | Cyclopropyl-methyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | 0 | 96-99 |
| 3.052 | 1-Methoxy-eth-1-yl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | 0 | 99-101 |
| 3.053 | 1-Methoxy-eth-1-yl | H | tert.-Butyl | Propargyl | 0 | 0 | 1,46 (s; 9H); 1,58 (d; 3H); 2,53 (t; 1H); 3,36 (s; 3H); 4,91 (d; 2H); 5,08 (q; 1H); 6,67 (bs, 1H, NH) |
| 3.054 | 1-Methoxy-eth-1-yl | H | Cyclopropyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | 0 | 89-92 |
| 3.055 | 1-Methoxy-eth-1-yl | H | Cyclopropyl | Propargyl | 0 | 0 | 94-98 |
| 3.056 | 1-Methoxy-eth-1-yl | H | sek.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | 0 | 76-79 |
| 3.057 | Methoxymethyl | H | tert.-Butyl | H | 0 | 0 | 1,52 (s; 9H); 3,50 (s; 3H); 5,05 (s; 2H); 7,26 (bs; 1H, NH) |
| 3.058 | Methoxymethyl | H | sek.-Butyl | H | 0 | 0 | 50-56 |
| 3.059 | Methoxymethyl | H | Cyclopropyl | H | 0 | 0 | 56-62 |


Tabelle 3 (Fortsetzung)

| Nr. | R ¹ | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | X | Y | Fp. [°C]/ ¹ H-NMR (250 MHz, CDCl ₃), δ in ppm |
|-------|--------------------|----------------|---------------------|-------------------------------------|---|---|--|
| 3.060 | Ethyl | H | Cyclopropyl | Me | 0 | 0 | 0,58-0,96 (m; 4H); 1,32 (t; 3H); 2,90 (m; 1H); 3,09 (q; 2H); 3,91 (s; 3H); 7,91 (bs, 1H, NH) |
| 3.061 | Ethyl | H | Cyclopropyl | H | 0 | 0 | 0,80-1,10 (m; 4H); 1,30 (t; 3H); 3,00 (m; 1H); 3,26 (q; 2H); 8,06 (bs, 1H, NH) |
| 3.062 | Cyclohexyl | H | tert.-Butyl | H | 0 | 0 | 126-129 |
| 3.063 | Cyclohexyl | H | Cyclopropyl | H | 0 | 0 | 140-144 |
| 3.064 | Cyclohexyl | H | 1-Cyclopropyl-ethyl | H | 0 | 0 | 125-130 |
| 3.065 | Cyclopropyl | H | tert.-Butyl | H | 0 | 0 | 88-91 |
| 3.066 | Cyclopropyl | H | Cyclopropyl | H | 0 | 0 | 98-103 |
| 3.067 | Cyclopropyl | H | 1-Cyclopropyl-ethyl | H | 0 | 0 | 55-60 |
| 3.068 | 1-Methylcyclohexyl | H | tert.-Butyl | H | 0 | 0 | 108-112 |
| 3.069 | 1-Methylcyclohexyl | H | Cyclopropyl | H | 0 | 0 | 102-107 |
| 3.070 | Cyclopropyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | 0 | 150-152 |
| 3.071 | iso-Propyl | H | tert.-Butyl | Ethyl | 0 | 0 | 69-72 |
| 3.072 | Ethyl | H | Cyclopropyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | 0 | 87-88 |

Tabelle 3 (Fortsetzung)

| Nr. | R ¹ | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | X | Y | Fp. [°C]/ ¹ H-NMR (250 MHz, CDCl ₃), δ in ppm |
|-------|------------------------------|----------------|-------------------------|----------------|---|---|---|
| 3.073 | Cyclopropyl | H | Cyclopropyl-methyl | H | 0 | 0 | 102-110 |
| 3.074 | Cyclopropyl | H | sek.-Butyl | H | 0 | 0 | 92-98 |
| 3.075 | Cyclopropyl | H | Cyclopentyl | H | 0 | 0 | 78-84 |
| 3.076 | Cyclopropyl | H | Cyclohexyl | H | 0 | 0 | 80-87 |
| 3.077 | 2-Methyltetrahydropyran-2-yl | H | tert.-Butyl | H | 0 | 0 | 93-96 |
| 3.078 | 2-Methyltetrahydropyran-2-yl | H | Cyclopropyl | H | 0 | 0 | 104-112 |
| 3.079 | 2-Methyl-norbornan-2-yl | H | Cyclopropyl | H | 0 | 0 | 133-136 |
| 3.080 | 4-F-Phenyl | H | tert.-Butyl | H | 0 | 0 | 93-96 |
| 3.081 | Cyclopropyl | H | 1,1-Dimethyl-2-propenyl | H | 0 | 0 | 1,24 (m; 2H); 1,56 (s; 6H); 3,20 (m; 1H); 5,20 (m; 2H); 6,09 (m; 1H); 7,26 (bs; 1H; NH) |
| 3.082 | Cyclopropyl | H | Benzyl | H | 0 | 0 | 145-159 |
| 3.083 | Cyclopropyl | H | 2-Methoxyethyl-yl | H | 0 | 0 | 91-96 |
| 3.084 | Cyclopropyl | H | 2-Propenyl | H | 0 | 0 | 109-114 |
| 3.085 | Methyl | H | tert.-Butyl | 2,4-(Br, Br) | 0 | 0 | 192-203 |
| | | | | 4-CN-Phenyl | | | |

Tabelle 3 (Fortsetzung)

| Nr. | R ¹ | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | X | Y | Fp. [°C]/ ¹ H-NMR (250 MHz, CDCl ₃), δ in ppm |
|--------|----------------|----------------|---------------------|---|---|---|---|
| 3.086* | Methyl | H | tert.-Butyl | -CH ₂ -CH=N-OC ₂ H ₅ | 0 | 0 | Hauptisomer: 1,24 (t; 3H); 1,46 (s; 3H); 2,68 (s; 3H); 4,16 (m; 2H); 4,84 (d; 2H); 7,08 (bs; 1H, NH), 7,49 (t; 1H) |
| 3.087 | Methyl | H | tert.-Butyl | Na ⁺ | 0 | 0 | 298-300 |
| 3.088 | Methyl | H | tert.-Butyl | K ⁺ | 0 | 0 | 256-257 |
| 3.089 | Methyl | H | Cyclobutyl | H | 0 | 0 | 119-124 |
| 3.090 | Methyl | H | 1,1-Dimethyl-propyl | H | 0 | 0 | 61-66 |
| 3.091 | Methyl | H | tert.-Butyl | NH ₄ ⁺ | 0 | 0 | 226-230 |
| 3.092 | Methyl | H | tert.-Butyl | -CH ₂ -CH=N-OCH ₃ | 0 | 0 | 83-90 |
| 3.093 | Methyl | H | tert.-Butyl | 4-CN-Phenyl | 0 | 0 | 119-125 |
| 3.094 | Methyl | H | tert.-Butyl | Propargyl | 0 | 0 | 93-96 |
| 3.095 | Methyl | H | 2,2-Dimethyl-propyl | H | 0 | 0 | 125-129 |
| 3.096 | Methyl | H | tert.-Butyl |  -N | 0 | 0 | 124-127 |
| 3.097 | Methyl | H | tert.-Butyl | H ₃ N ⁺ -CH(CH ₃) ₂ | 0 | 0 | 175-180 |
| 3.098 | 2-Furanyl | H | tert.-Butyl | H | 0 | 0 | 114-117 |

*) Isomerengemisch

Tabelle 3 (Fortsetzung)

| Nr. | R ¹ | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | X | Y | Fp. [°C]/ ¹ H-NMR (250 MHz, CDCl ₃), δ in ppm |
|-------|----------------|----------------|------------------------------|--|---|---|---|
| 3.099 | 2-Furanyl | H | Cyclopropyl | H | 0 | 0 | 124-127 |
| 3.100 | Methyl | H | tert.-Butyl | -CH ₂ -CH=CH-C ₆ H ₅ | 0 | 0 | |
| 3.101 | Methyl | H | sek.-Butyl | H | 0 | 0 | 78-83 |
| 3.102 | Methyl | H | 2-Methoxy- eth-1-yl | H | 0 | 0 | 74-77 |
| 3.103 | iso-Propyl | H | Cyclopropyl | Na ⁺ | 0 | 0 | 241 |
| 3.104 | iso-Propyl | H | Cyclopropyl | K ⁺ | 0 | 0 | 208-209 |
| 3.105 | Methyl | H | 1,1-Dimethyl- -2-propenyl | H | 0 | 0 | 58-82 |
| 3.106 | iso-Propyl | H | Cyclopropyl | H ₃ N ⁺ -CH(CH ₃) ₂ | 0 | 0 | 170-176 |
| 3.107 | iso-Propyl | H | Cyclopropyl | NH ₄ ⁺ | 0 | 0 | 221-223 |
| 3.108 | Methyl | H | tert.-Butyl | 2-Cl-Phenyl | 0 | 0 | 168-170 |
| 3.109 | Methyl | H | tert.-Butyl | 3-Cl-Phenyl | 0 | 0 | 125-128 |
| 3.110 | Methyl | H | Cyclopentyl | H | 0 | 0 | 99-104 |
| 3.111 | Methyl | H | tert.-Butyl | 4-Cl-Phenyl | 0 | 0 | 112-117 |
| 3.112 | Methyl | H | tert.-Butyl | 4-F-Phenyl | 0 | 0 | 173-176 |
| 3.113 | Methyl | H | tert.-Butyl | 4-CH ₃ -Phenyl | 0 | 0 | 132-134 |
| 3.114 | Methyl | H | tert.-Butyl | 2-F-Phenyl | 0 | 0 | 148-150 |
| 3.115 | Methyl | H | tert.-Butyl | Phenyl | 0 | 0 | 152-157 |
| 3.116 | Methyl | H | tert.-Butyl | Methyl | 0 | 0 | 129-132 |
| 3.117 | Methyl | H | tert.-Butyl | iso-Propyl | 0 | 0 | 108-112 |
| 3.118 | Methyl | H | tert.-Butyl | tert.-Butyl | 0 | S | 1,46 (s; 9H); 1,60 (s; 9H); 2,71 (s; 3H); 6,75 (bs; 1H, NH) |
| 3.119 | Methyl | H | tert.-Butyl | Cyclohexyl | 0 | 0 | 86-90 |

Tabelle 3 (Fortsetzung)

| Nr. | R ¹ | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | X | Y | Fp. [°C]/ ¹ H-NMR (250 MHz, CDCl ₃), δ in ppm |
|-------|------------------------|----------------|----------------|----------------|---|---|--|
| 3.120 | 2,4,6-Trl-methylphenyl | H | tert.-Butyl | H | 0 | 0 | 1,53 (s;9H), 2,08 (s;3H), 2,10 (s;6H), 6,94 (s;2H), 7,30 (bs;1H,NH) |
| 3.121 | Ethyl | Methyl | Ethyl | Methyl | 0 | 0 | 1,17 und 1,27 (2t; 3H+3H); 1,35 (t; 3H); 2,89 und 3,12 (2s; 3H+3H); 3,18 (q; 2H); 3,25 und 3,63 (2q; 2H+2H); 3,84 (s; 3H)* |
| 3.122 | Ethyl | Methyl | Ethyl | H | 0 | 0 | 1,27 und 1,30 (2t; 3H+3H); 1,34 (t; 3H), 3,18 und 3,28 (2s; 3H+3H); 3,24 (q; 2H), 3,67 und 3,68 (2q; 2H+2H)* |
| 3.123 | Methyl | H | Cyclopropyl | Methyl | 0 | 0 | 0,60-0,92 (m; 4H); 2,70 (s; 3H); 2,93 (m; 1H); 3,92 (s; 3H); 8,27 (bs; 1H, NH) |
| 3.124 | iso-Propyl | H | Cyclopropyl | Methyl | 0 | 0 | 0,60-0,93 (m; 4H); 1,36 (d; 6H); 2,92 (m; 1H); 3,70 (sp; 1H); 3,89 (s; 3H); 7,84 (bs; 1H, NH) |
| 3.125 | Ethyl | H | tert.-Butyl | Methyl | 0 | 0 | 1,32 (t; 3H); 1,48 (s; 9H); 3,09 (q; 2H); 3,88 (s; 3H); 7,23 (bs; 1H, NH) |
| 3.126 | Ethyl | H | tert.-Butyl | H | 0 | 0 | 1,36 (t; 3H); 1,52 (s; 9H); 3,28 (q; 2H); 7,22 (bs; 1H, NH) |

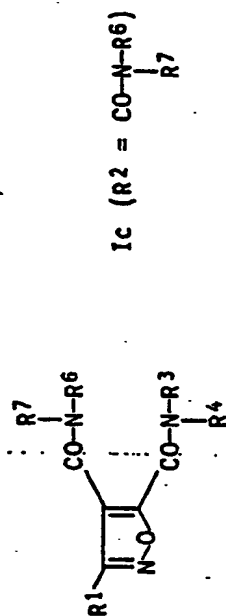
*) Mischung aus 2 Rotameren

Tabelle 4



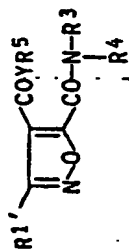
| Nr. | R ¹ | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | X | Y | Fp. [°C]/ ¹ H-NMR (250 MHz, CDCl ₃), δ in ppm |
|-------|----------------|----------------|---------------------------|-------------------------------------|---|---|---|
| 4.001 | Methyl | H | tert.-Butyl | H | O | O | 142-147 |
| 4.002 | Ethyl | H | tert.-Butyl | H | O | O | 124-127 |
| 4.003 | Iso-Propyl | H | tert.-Butyl | H | O | O | 142-145 |
| 4.004 | Iso-Propyl | H | Cyclopropyl | H | O | O | 136-138 |
| 4.005 | Methyl | H | tert.-Butyl | H | S | O | 134 |
| 4.006 | Methyl | H | Cyclopropyl | H | S | O | 131 |
| 4.007 | Methyl | H | Iso-Propyl | H | S | O | 111 |
| 4.008 | Methyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | S | O | 116-117 |
| 4.009 | Iso-Propyl | H | 3-CF ₃ -Phenyl | H | S | O | 144 |
| 4.010 | Iso-Propyl | H | tert.-Butyl | H | S | O | 164 |
| 4.011 | Iso-Propyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | S | O | 166-167 |
| 4.012 | Phenyl | H | 4-Cl-Phenyl | H | S | O | 169 |
| 4.013 | Phenyl | H | Cyclopropyl | H | S | O | 167 |
| 4.014 | Phenyl | H | Cyclopropyl | -N=C(CH ₃) ₂ | S | O | 148-149 |
| 4.015 | Iso-Propyl | H | tert.-Butyl | Methyl | S | O | 133-134 |
| 4.016 | Methyl | H | 2,4,6-Trimethylphenyl | -N=C(CH ₃) ₂ | O | O | 135 |
| 4.017 | Iso-Propyl | H | tert.-Butyl | Methyl | O | O | 121-123 |

Tabelle 5



| Nr. | R ¹ | R ³ | R ⁴ | R ⁶ | R ⁷ | Fp. [°C]/ ¹ H-NMR (250 MHz, CDCl ₃), δ in ppm |
|------|----------------|------------------------------------|----------------|----------------|----------------|--|
| 5.01 | Methyl | -(CH ₂) ₅ - | | H | tert.-Butyl | 74-75 |
| 5.02 | 4-F-Phenyl | -(CH ₂) ₅ - | | H | tert.-Butyl | 1,40 (s; 9H), 1,73 (m; 6H), 3,40 (m; 2H), 3,73 (m; 2H), 7,14 (m; 2H), 7,59 (bs; 1H, NH), 7,73 (m; 2H) |
| 5.03 | iso-Propyl | H | tert.-Butyl | H | tert.-Butyl | 111-114 |
| 5.04 | Methyl | H | tert.-Butyl | H | H | 155-158 |
| 5.05 | Ethyl | -(CH ₂) ₅ - | | H | tert.-Butyl | 1,34 (t; 3H), 1,41 (s; 9H), 1,50-1,80 (m; 6H), 3,00 (q; 2H), 3,34-3,43 (m; 2H), 3,68-3,76 (m; 2H), 8,10 (bs; 1H, NH) |
| 5.06 | iso-Propyl | -(CH ₂) ₅ - | | H | tert.-Butyl | 76-77 |
| 5.07 | iso-Propyl | -(CH ₂) ₅ - | | H | Cyclopropyl | 50-52 |
| 5.08 | Cyclopropyl | -(CH ₂) ₅ - | | H | tert.-Butyl | 65 |
| 5.09 | Methyl | H | Cyclopropyl | H | Cyclopropyl | 110-114 |

Tabelle 6



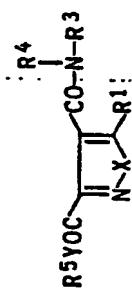
Id (R2 = CO-YR5)

| Nr. | R1' | R3 | R4 | R5 | Y | Fp. [°C]/ ¹ H-NMR (250 MHz, COCl ₃), δ [ppm] |
|------|---|----|--|-------------------------------------|---|--|
| 6.01 | CH ₂ =C(CH ₃)- | H | iso-Propyl | Methyl | 0 | 1.29 (d; 6H), 2.12 (bs; 3H), 3.94 (s; 3H) 4.26 (sp; 1H) 5.42 (m; 2H), 8.05 (bs; 1H, NH) |
| 6.02 | CH ₂ =C(CH ₃)- | H | Cyclopropyl | Methyl | 0 | 0.63-0.92 (m; 4H), 2.10 (bs; 3H), 2.93 (m; 1H), 3.93 (s; 3H) 5.40 (m; 2H), 8.40 (bs; 1H, NH) |
| 6.03 | CH ₂ =C(CH ₃)- | H | tert.-Butyl | Methyl | 0 | 1.48 (s; 9H), 2.1 (bs; 3H), 3.93 (s; 3H) 5.40 (m; 2H), 8.07 (bs; 1H, NH) |
| 6.04 | CH ₂ =C(CH ₃)- | H | iso-Propyl | H | 0 | 84-87 |
| 6.05 | CH ₂ =C(CH ₃)- | H | Cyclopropyl | H | 0 | 96-100 |
| 6.06 | CH ₂ =C(CH ₃)- | H | tert.-Butyl | H | 0 | 1.55 (s; 9H), 2.15 (bs; 3H), 5.40 (m; 2H) 7.15 (bs; 1H, NH) |
| 6.07 | CH ₂ =C(CH ₃)- | H | -C(CH ₃) ₂ C≡CH | H | 0 | 1.82 (s; 6H), 2.17 (bs; 3H), 2.53 (s; 1H), 5.40 (m; 2H), 7.43 (bs; 1H, NH) |
| 6.08 | CH ₂ =C(CH ₃)- | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | 1.44 (s; 9H), 2.07 und 2.10 (2s; 6H) 2.17 (s; 3H), 5.42 (m; 2H), 8.17 (bs; 1H, NH) |
| 6.09 | E-C ₆ H ₅ -CH=CH- | H | tert.-Butyl | Methyl | 0 | 1.48 (s; 9H), 4.00 (s; 3H), 7.12-7.61 (m; 7H), 9.13 (bs; 1H, NH) |
| 6.10 | E-C ₆ H ₅ -CH=CH- | H | tert.-Butyl | H | 0 | 75-80 |
| 6.11 | CH ₂ =C(CH ₃)- | H | -C(CH ₃) ₂ C≡CH | Methyl | 0 | 1.78 (s; 6H), 2.10 (s; 3H), 2.41 (s; 1H) 3.93 (s; 3H), 5.41 (m; 2H), 8.63 (bs; 1H, NH) |

Tabelle 6 (Fortsetzung)

| Nr. | R ¹ | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | Y | Fp. [°C]/ ¹ H-NMR (250 MHz, CDCl ₃), δ [ppm] |
|------|---|----------------|--|-------------------------------------|---|---|
| 6.12 | CH ₂ =C(C ₂ H ₅)- | H | tert.-Butyl | H | 0 | 80-81 |
| 6.13 | CH ₂ =C(C ₂ H ₅)- | H | -C(CH ₃) ₂ C≡CH | H | 0 | 1,08 (t;3H), 1,80 (s;6H), 2,48 (m;2H), 2,50 (s;1H), 5,30 und 5,44 (2s;2H), 7,50 (bs;1H, NH) |
| 6.14 | CH ₂ =C(C ₂ H ₅)- | H | Cyclopropyl | H | 0 | 73-74 |
| 6.15 | CH ₂ =C(C ₂ H ₅)- | H | Cyclopropyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | 48-52 |
| 6.16 | CH ₂ =C(1-C ₃ H ₇)- | H | tert.-Butyl | H | 0 | 114-117 |
| 6.17 | E-CH ₃ -CH=CH- | H | tert.-Butyl | H | 0 | 64-69 |
| 6.18 | CH ₂ =C(1-C ₃ H ₇)- | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | 1,10 (d;6H), 1,48 (s;9H), 2,02 und 2,12 (2s;6H), 2,70 (m;1H), 5,34 und 5,41 (2s;2H), 8,36 (bs;1H, NH) |
| 6.19 | E-CH ₃ -CH=CH- | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | 78-82 |
| 6.20 | CH ₂ =C(1-C ₃ H ₇)- | H | tert.-Butyl | Methyl | 0 | 1,12 (d;6H), 1,48 (s;9H), 2,66 (m;1H), 3,90 (s;3H), 5,24 und 5,39 (2s;2H), 8,50 (bs;1H, NH) |
| 6.21 | CH ₂ =C(1-C ₃ H ₇)- | H | Cyclopropyl | Methyl | 0 | 0,60-0,94 (m;4H), 1,11 (d;6H), 2,64 (m;1H), 3,00 (m;1H), 3,88 (s;3H), 5,24 und 5,39 (2s;2H), 8,87 (bs;1H, NH) |
| 6.22 | E-CH ₃ -CH=CH- | H | tert.-Butyl | Methyl | 0 | 1,48 (s;9H), 1,95 (dd;3H), 3,94 (s;3H), 6,43-6,79 (m;2H), 9,07 (bs;1H, NH) |

Tabelle 7



Ib (R2 = CO-YR5)

| Nr. | R ¹ | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | X | Y | Fp. [°C]/ ¹ H-NMR (250 MHz, COCl ₂), δ in ppm |
|------|----------------|----------------|----------------|-------------------------------------|---|---|---|
| 7.01 | Methyl | H | tert.-Butyl | Methyl | 0 | 0 | 97-99 |
| 7.02 | Methyl | H | tert.-Butyl | H | 0 | 0 | 152-154 |
| 7.03 | Iso-Propyl | H | tert.-Butyl | -N=C(CH ₃) ₂ | 0 | 0 | 58-61 |

Die herbizide Wirkung der Carbonsäureamide der Formeln Ia', Ib', Ic' und Id ließ sich durch Gewächshausversuche zeigen:

Als Kulturgefäße dienten Plastikblumentöpfe mit lehmigem Sand mit etwa 3,0 % Humus als Substrat. Die Samen der Testpflanzen wurden nach Arten getrennt eingesät.

Bei Voraufaufbehandlung wurden die in Wasser suspendierten oder emulgierten Wirkstoffe direkt nach Einsaat mittels fein verteilender Düsen aufgebracht. Die Gefäße wurden leicht beregnet, um Keimung und Wachstum zu fördern und anschließend mit durchsichtigen Plastikhauben abgedeckt, bis die Pflanzen angewachsen waren. Diese Abdeckung bewirkt ein gleichmäßiges Keimen der Testpflanzen, sofern dies nicht durch die Wirkstoffe beeinträchtigt wurde.

Zum Zwecke der Nachaufaufbehandlung wurden die Testpflanzen je nach Wuchsform erst bei einer Wuchshöhe von 3 bis 15 cm mit den in Wasser suspendierten oder emulgierten Wirkstoffen behandelt. Die Aufwandmenge für die Nachaufaufbehandlung betrug 1,0 kg/ha a.S.

Die Pflanzen wurden artenspezifisch bei Temperaturen von 10-25° C bzw. 20-35° C gehalten. Die Versuchsperiode erstreckte sich über 2 bis 4 Wochen. Während dieser Zeit wurden die Pflanzen gepflegt und ihre Reaktion auf die einzelnen Behandlungen wurde ausgewertet.

Bewertet wurde nach einer Skala von 0 bis 100. Dabei bedeutet 100 kein Aufgang der Pflanzen bzw. völlige Zerstörung zumindest der oberirdischen Teile und 0 keine Schädigung oder normaler Wachstumsverlauf.

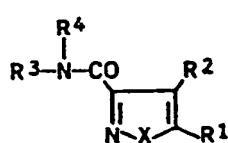
Die in den Gewächshausversuchen verwendeten Pflanzen setzten sich aus folgenden Arten zusammen:

| Lateinischer Name | Deutscher Name |
|--------------------------|-------------------|
| Cassia tora | - |
| Chenopodium album | Weißer Gänsefuß |
| Chrysanthemum coronarium | Kronenwucherblume |
| Ipomoea spp. | Prunkwindearten |
| Polygonum persicaria | Flohnkötterich |
| Stellaria media | Vogelstermniere |
| Triticum aestivum | Winterweizen |

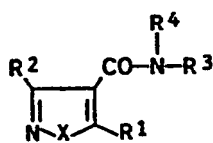
Mit 1,0 kg/ha a.S. im Nachaufaufverfahren eingesetzt, lassen sich mit den Verbindungen 3.002, 3.005, 3.006, 3.008, 3.016, 3.017, 3.018, 3.019, 3.020, 3.023, 3.028, 3.029, 3.037, 3.052, 3.053, 6.04, 6.05, 6.06 und 6.08 breitblättrige unerwünschte Pflanzen sehr gut bekämpfen. Die Carbonsäureamide 3.006, 3.016 bis 3.020, 3.028, 3.029, 3.037, 3.052, 3.053, 6.04, 6.05, 6.06 und 6.08 sind gleichzeitig verträglich für Gramineen-Kulturen wie Weizen, Mais und Reis.

Ansprüche

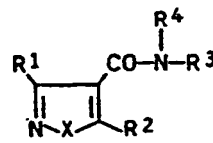
1. Carbonsäureamide der Formeln Ia, Ib, Ic und Id



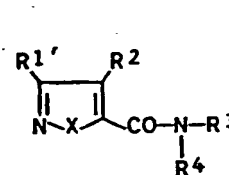
Ia



Ib



Ic



Id

in denen die Variablen folgende Bedeutung haben:

X Sauerstoff oder Schwefel;

R¹ - Wasserstoff, Halogen, C₁-C₆-Alkyl, welches ein bis fünf Halogenatome und/oder einen Cyano- und/oder bis zu zwei der folgenden Reste tragen kann: C₁-C₄-Alkoxy, partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio oder partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₄-Alkylthio; eine C₁-C₄-Alkoxy- oder C₁-C₄-Alkylthiogruppe, eine partiell oder vollständig halogenierte C₁-C₄-Alkoxy-

- gruppe, eine partiell oder vollständig halogenierte C₁-C₄-Alkylthiogruppe;
- die Benzylgruppe, die ein- bis dreimal durch C₁-C₄-Alkyl, partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₄-Alkylthio, Halogen, Cyano oder Nitro substituiert sein kann;
 - 5 - die Phenylgruppe, welche noch einen bis drei der folgenden Reste tragen kann: Cyano, Nitro, Halogen, C₁-C₆-Alkyl, partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Alkylthio und/oder partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₆-Alkylthio;
 - die Phenoxy- oder die Phenylthiogruppe, wobei beide Gruppen ein- bis dreimal durch C₁-C₄-Alkyl, partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₄-Alkylthio, Halogen, Cyano oder Nitro substituiert sein können;
 - 10 - ein 5- bis 6-gliedriger gesättigter oder aromatischer heterocyclischer Rest, enthaltend ein oder zwei Heteroatome, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff, der ein oder zwei der folgenden Substituenten tragen kann: Halogen, C₁-C₃-Alkyl, C₁-C₃-Alkoxy und C₁-C₃-Alkoxycarbonyl;
 - 15 - eine durch C₃-C₈-Cycloalkyl substituierte C₁-C₆-Alkylgruppe,
 - eine C₂-C₆-Alkenylgruppe, deren Doppelbindung epoxidiert sein kann, oder eine C₂-C₆-Alkynylgruppe, wobei beide Gruppen ein- bis dreimal durch Halogen, C₁-C₃-Alkoxy und/oder einmal durch Cyclopropyl oder Phenyl substituiert sein können, wobei der Phenylrest zusätzlich bis zu drei der folgenden Substituenten tragen kann: Halogen, Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, das unsubstituiert oder partiell oder vollständig halogeniert sein kann, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Alkylthio, die beide unsubstituiert oder partiell oder
 - 20 vollständig halogeniert sein können,
 - eine C₃-C₈-Cycloalkyl- oder eine C₃-C₆-Cycloalkenylgruppe, wobei beide Gruppen ein- bis dreimal durch C₁-C₄-Alkyl oder Halogen substituiert sein können;
 - R¹ - eine durch C₃-C₈-Cycloalkyl substituierte C₁-C₆-Alkylgruppe;
 - 25 - eine C₂-C₆-Alkenylgruppe, deren Doppelbindung epoxidiert sein kann, oder eine C₂-C₆-Alkynylgruppe, wobei beide Gruppen ein- bis dreimal durch Halogen, C₁-C₃-Alkoxy und/oder einmal durch Cyclopropyl oder Phenyl substituiert sein können, wobei der Phenylrest zusätzlich bis zu drei der folgenden Substituenten tragen kann: Halogen, Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, das unsubstituiert oder partiell oder vollständig halogeniert sein kann, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Alkylthio, die beide unsubstituiert oder partiell oder
 - 30 vollständig halogeniert sein können;
 - eine C₃-C₆-Cycloalkenylgruppe, die ein- bis dreimal durch Halogen oder C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann;
 - R² - eine Formylgruppe, eine 4,5-Dihydrooxazol-2-ylgruppe,
 - ein Rest COYR⁵ oder CONR⁶R⁷, wobei die Variablen die folgende Bedeutung haben:
 - 35 Y Sauerstoff oder Schwefel;
 - R⁵ - Wasserstoff;
 - eine C₁-C₆-Alkylgruppe, welche ein bis fünf Halogenatome und/oder bis zu drei Hydroxy- und/oder C₁-C₄-Alkoxygruppen und/oder einen der folgenden Reste tragen kann:
 - Cyano,
 - 40 - C₁-C₄-Alkoxy-C₂-C₄-alkoxy,
 - C₁-C₃-Alkylthio,
 - C₁-C₃-Alkylamino, Di-(C₁-C₃)-alkylamino, C₃-C₆-Cycloalkylamino oder Di-(C₃-C₆)-cycloalkylamino,
 - Trimethylsilyl,
 - C₁-C₃-Alkylsulfinyl oder C₁-C₃-Alkylsulfonyl, Carboxyl, C₁-C₃-Alkoxycarbonyl, C₁-C₃-Alkoxycarbonyl-C₁-
 - 45 C₃-alkoxy oder C₁-C₃-Alkoxycarbonyl-C₁-C₃-alkoxy-C₁-C₃-alkoxycarbonyl,
 - Di-(C₁-C₃)-alkylaminocarbonyl,
 - Di-(C₁-C₃)-alkoxyphosphonyl,
 - C₁-C₆-Alkaniminoxy oder C₅-C₆-Cycloalkaniminoxy,
 - N-Phthalimido, N-Succinimido, Benzoyloxy, Benzoyl, wobei diese cyclischen Reste zusätzlich eine bis drei
 - 50 der folgenden Gruppen tragen können: Halogen, C₁-C₃-Alkyl oder C₁-C₃-Alkoxy,
 - einen 5- oder 6-gliedrigen gesättigten heterocyclischen Rest oder einen 5- oder 6-gliedrigen heteroaromatischen Rest mit Jeweils bis zu 3 Heteroatomen, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff, wobei zwei Sauerstoff- und/oder Schwefelatome nicht direkt benachbart sein können und wobei die Heterocyclen noch einen oder zwei der folgenden Substituenten tragen können: Halogen, C₁-C₃-Alkyl,
 - 55 C₁-C₃-Alkoxy oder C₁-C₃-Alkoxycarbonyl;
 - Phenyl, das noch bis zu drei der folgenden Substituenten tragen kann: Halogen, Nitro, Cyano, C₁-C₃-Alkyl, partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₃-Alkyl, C₁-C₃-Alkoxy oder partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₃-Alkoxy;

- einen Rest $-CR^{10} = N-R^{11}$, wobei R^{10} und R^{11} die folgende Bedeutung haben:

R^{10} Wasserstoff oder C_1-C_6 -Alkyl und

R^{11} C_1-C_6 -Alkoxy, C_3-C_6 -Alkenyloxy oder C_3-C_6 -Alkinyloxy, die jeweils bis zu 3 Halogenatome und/oder einen Phenylrest mit gewünschtenfalls bis zu drei der folgenden Reste tragen können: Halogen, Nitro,

5 Cyano, C_1-C_3 -Alkyl oder C_1-C_3 -Alkoxy;

Phenoxy, das noch bis zu drei der folgenden Substituenten tragen kann:

Halogen, Nitro, Cyano, C_1-C_3 -Alkyl oder C_1-C_3 -Alkoxy;

C_1-C_6 -Alkylamino, Di- (C_1-C_6) -alkylamino oder Phenylamino, wobei der Aromat zusätzlich bis zu drei der folgenden Reste tragen kann: Halogen, Nitro, Cyano, C_1-C_3 -Alkyl oder C_1-C_3 -Alkoxy;

10 - C_3-C_8 -Cycloalkyl;

- C_3-C_6 -Alkenyl, C_5-C_6 -Cycloalkenyl, C_3-C_6 -Alkynyl, wobei diese Reste eine der folgenden Gruppen tragen können: Hydroxy, Halogen, C_1-C_4 -Alkoxy oder Phenyl, wobei der Aromat seinerseits eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Halogen, Nitro, Cyano, C_1-C_4 -Alkyl, partiell oder vollständig halogeniertes C_1-C_4 -Alkyl oder C_1-C_4 -Alkoxy;

15 - Phenyl, das eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Halogen, Nitro, Cyano, C_1-C_4 -Alkyl, partiell oder vollständig halogeniertes C_1-C_4 -Alkyl, C_1-C_4 -Alkoxy, partiell oder vollständig halogeniertes C_1-C_4 -Alkoxy oder C_1-C_4 -Alkoxy-carbonyl;

- einen fünf- oder sechsgliedrigen heterocyclischen Rest mit bis zu drei Heteroatomen, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff, wobei zwei Sauerstoff- und/oder Schwefelatome nicht direkt benachbart sein können, und wobei die Heterocyclen noch einen oder zwei der folgenden Substituenten tragen können: Halogen, C_1-C_3 -Alkoxy oder C_1-C_3 -Alkoxy-carbonyl;

- einen Benzotriazolrest;

- N-Phthalimido, Tetrahydrophthalimido, Succinimido, Maleinimido;

- die 2,2-Dimethyl-1,3-dioxolan-4-ylmethyl- oder 1,3-Dioxolan-2-on-4-ylmethylgruppe;

20 - im Falle $Y = O$: ein Äquivalent eines Kations aus der Gruppe der Alkali- und Erdalkalimetalle, Mangan, Kupfer, Eisen, Ammonium und mit bis zu 4 C_1-C_3 -Alkylgruppen substituiertes Ammonium; oder

- ein Rest $-N = CR^8R^9$, wobei

R^8 , R^9 Wasserstoff; C_1-C_4 -Alkyl, das unsubstituiert oder partiell oder vollständig halogeniert sein kann und einen C_1-C_3 -Alkoxy- oder Phenylrest tragen kann, wobei der aromatische Rest seinerseits noch ein- bis dreimal durch Halogen, Nitro, Cyano, C_1-C_3 -Alkyl, partiell oder vollständig halogeniertes C_1-C_3 -Alkyl, C_1-C_3 -Alkoxy oder partiell oder vollständig halogeniertes C_1-C_3 -Alkoxy substituiert sein kann; C_3-C_6 -Cycloalkyl; C_1-C_4 -Alkoxy; Furanyl oder Phenyl, das zusätzlich bis zu 3 der folgenden Substituenten tragen kann: Halogen, Nitro, Cyano, C_1-C_3 -Alkyl, partiell oder vollständig halogeniertes C_1-C_3 -Alkyl, C_1-C_3 -Alkoxy oder partiell oder vollständig halogeniertes C_1-C_3 -Alkoxy; oder R^8 und R^9 gemeinsam eine Methylenkette mit 4 bis 7 Gliedern bedeuten;

- einen Rest $-W-Z$, wobei W eine C_2-C_4 -Alkylenkette, eine Ethoxyethylenkette, eine But-2-enylen- oder eine But-2-inylenkette bedeutet und Z einen in ω -Stellung an W gebundenen Molekülteil, der den gleichen Molekülteil darstellt, der in α -Stellung von W mit W verknüpft ist, bedeutet;

40 R^6 - Wasserstoff, C_1-C_6 -Alkyl oder C_3-C_8 -Cycloalkyl und

R^7 - Wasserstoff, C_1-C_6 -Alkyl, $-C(OR^{12}) = N-H$ oder $-C(OR^{12}) = N-(C_1-C_4)$ -alkyl, wobei R^{12} C_1-C_4 -Alkyl bedeutet oder

R^6, R^7 gemeinsam eine Methylenkette mit 4 oder 5 Gliedern;

R^3 - Wasserstoff;

45 - C_1-C_6 -Alkyl, das einen bis drei der folgenden Substituenten tragen kann: Hydroxy, Halogen, C_1-C_4 -Alkoxy, C_1-C_4 -Alkylthio oder Di- (C_1-C_4) -alkylamino;

- C_3-C_8 -Cycloalkyl, das ein- bis dreimal durch Halogen, C_1-C_4 -Alkyl und partiell oder vollständig halogeniertes C_1-C_4 -Alkyl substituiert sein kann;

R^4 - Wasserstoff, Hydroxyl, eine C_1-C_4 -Alkoxygruppe;

50 - eine C_1-C_6 -Alkylgruppe, die einen bis drei der folgenden Reste tragen kann: Halogen, Cyano, C_1-C_4 -Alkoxy, partiell oder vollständig halogeniertes C_1-C_4 -Alkoxy, C_1-C_4 -Alkylthio, partiell oder vollständig halogeniertes C_1-C_4 -Alkylthio, Di- C_1-C_4 -alkylamino, C_3-C_8 -Cycloalkyl oder Phenyl, wobei der Phenylring seinerseits einen bis drei der folgenden Reste tragen kann: Halogen, Cyano, Nitro, C_1-C_4 -Alkyl, partiell oder vollständig halogeniertes C_1-C_4 -Alkyl, C_1-C_4 -Alkoxy, partiell oder vollständig halogeniertes C_1-C_4 -Alkoxy,

55 C_1-C_4 -Alkylthio oder partiell oder vollständig halogeniertes C_1-C_4 -Alkylthio;

- eine C_3-C_8 -Cycloalkylgruppe, die einen bis drei der folgenden Reste tragen kann: Halogen, Nitro, Cyano, C_1-C_6 -Alkyl, partiell oder vollständig halogeniertes C_1-C_6 -Alkyl, C_1-C_4 -Alkoxy oder partiell oder vollständig halogeniertes C_1-C_4 -Alkoxy;

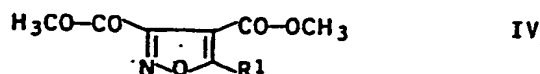
- eine C₃-C₆-Alkenyl- oder C₃-C₆-Alkynylgruppe, die jeweils ein- bis dreimal durch Halogen und/oder einmal durch Phenyl substituiert sein können, wobei der Phenylrest seinerseits eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, Halogen, Cyano oder Nitro;
 - eine Di-(C₁-C₄)-alkylaminogruppe;
 - ein 5- bis 6-gliedriger heterocyclischer gesättigter oder aromatischer Rest mit einem oder zwei Heteroatomen, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff, der ein- bis dreimal durch C₁-C₄-Alkyl oder Halogen substituiert sein kann;
 - eine Phenylgruppe, die eine bis vier der folgenden Gruppen tragen kann: C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, Halogen, Nitro, Cyano, Formyl, C₁-C₄-Alkanoyl, C₁-C₄-Halogenalkanoyl oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl;
 - eine Naphthylgruppe, die ein- bis dreimal durch C₁-C₄-Alkyl oder Halogen substituiert sein kann;
- oder
- R³, R⁴ gemeinsam eine Methylenkette mit 4 bis 7 Gliedern, welche durch Sauerstoff, Schwefel oder N-Methyl unterbrochen sein kann, oder den Rest -(CH₂)₃-CO-,
- wobei im Falle der Verbindungen Ia bis Ic R³ und R⁴ nicht gleichzeitig Wasserstoff bedeuten, wenn
- R¹ Wasserstoff, Methyl oder Phenyl und R² CONH₂, CO₂H oder CO₂CH₃ bedeuten oder wenn
 - X Sauerstoff, R¹ CH(OCH₂CH₃)₂ und R² CONH₂ bedeuten,
- sowie deren umweltverträglichen Salze.
2. Carbonsäureamide der Formeln Ia, Ib, Ic, Id nach Anspruch 1, wobei R³ Wasserstoff bedeutet.
3. Carbonsäureamide der Formeln Ia, Ib, Ic nach Anspruch 1, in denen
- R¹ Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl oder C₃-C₆-Cycloalkyl;
 - R² COYR⁵, wobei Y für Sauerstoff und R⁵ für Wasserstoff oder den Rest -N=CR⁸R⁹ stehen, wobei
 - R⁸, R⁹ dabei unabhängig voneinander Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl und C₃-C₆-Cycloalkyl bedeuten oder
- zusammen eine C₄-C₇-Alkylenkette bilden;
- R³ Wasserstoff und
- R⁴ C₁-C₄-Alkyl oder C₃-C₈-Cycloalkyl bedeuten.
4. Carbonsäureamide der Formel Ia nach den Ansprüchen 1 bis 3.
5. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen Ia und Ib gemäß Anspruch 1, in denen R² CO₂CH₃ und X Sauerstoff bedeutet, dadurch gekennzeichnet, daß man das Hydroxamsäurechlorid der Formel II



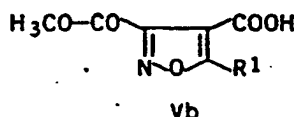
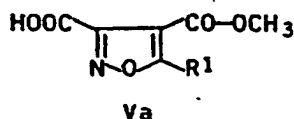
in an sich bekannter Weise in Gegenwart einer Base mit einem β-Ketoester der Formel III



umsetzt, den so erhaltenen Dimethyldiester IV



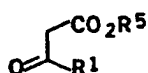
anschließend zunächst mit einem Äquivalent einer wäßrigen Base zu den Monoestern Va und Vb



hydrolysiert und Va und Vb danach getrennt oder im Gemisch zuerst in an sich bekannter Weise in die Halogenide oder andere aktivierte Formen der Carbonsäuren überführt und diese Derivate anschließend mit einem substituierten Amin der Formel VIa

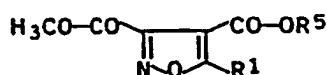
HNR^3R^4 VIa
amidiert.

6. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen Ia gemäß Anspruch 1, in denen R^2 CO_2R^5 , X Sauerstoff und R^5 nicht Wasserstoff oder Methyl bedeuten, dadurch gekennzeichnet, daß man das Hydroxamsäurechlorid II in an sich bekannter Weise in Gegenwart einer Base mit einem β -Ketoester der Formel IIIa



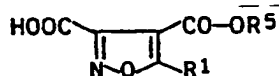
IIIa

umsetzt, den so erhaltenen Diester IVa



IVa

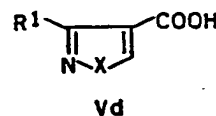
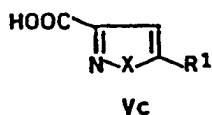
anschließend mit einem Verseifungsreagens zum Monoester Va'



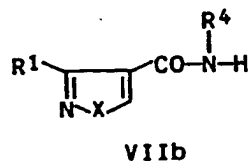
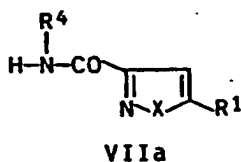
Va'

hydrolysiert, Va' in an sich bekannter Weise in die Halogenide oder andere aktivierte Formen der Carbonsäuren überführt und diese Derivate anschließend mit einem substituierten Amin VIa amidiert.

7. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen Ia und Ic gemäß Anspruch 1, in denen R^1 nicht Wasserstoff und R^2 Carboxyl oder Formyl und R^3 Wasserstoff bedeuten, dadurch gekennzeichnet, daß man eine Carbonsäure Vc oder Vd



in an sich bekannter Weise in die Halogenide oder andere aktivierte Formen der Carbonsäuren überführt, diese Derivate mit einem substituierten Amin VIa amidiert und das so erhaltene Amid VIIa bzw. VIIb

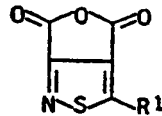


anschließend in an sich bekannter Weise in Gegenwart einer Base mit einem Carboxylierungs- oder einem Formylierungsreagens umsetzt.

8. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen Ia und Ib gemäß Anspruch 1, in denen R^2 eine Carboxyl-

gruppe und X Schwefel bedeutet, dadurch gekennzeichnet, daß man ein Isothiazoldicarbonsäureanhydrid VIII

5



VIII

10 in an sich bekannter Weise mit einem Amin VIa zu den Isomeren Ia und Ib umgesetzt und anschließend die Isomeren trennt.

9. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen Ia, Ib, Ic und Id gemäß Anspruch 1, in denen R² CO₂H bedeutet, dadurch gekennzeichnet, daß man einen entsprechenden Ester Ia, Ib, Ic oder Id, in dem R² CO₂R⁵ und R⁵ C₁-C₄-Alkyl bedeutet, in an sich bekannter Weise in Gegenwart einer wäßrigen Base hydrolysiert.

10. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen Ia, Ib, Ic und Id gemäß Anspruch 1, in denen R² eine Gruppe COYR⁵ oder CONR⁵R⁷ bedeutet, dadurch gekennzeichnet, daß man eine entsprechende Carbonsäure Ia, Ib, Ic bzw. Id (R²=CO₂H) zunächst in an sich bekannter Weise in die Halogenide oder andere aktivierte Derivate der Carbonsäuren überführt und diese Derivate anschließend in an sich bekannter Weise mit einer Verbindung IX

HYR⁵ IX

oder mit einem Amin VIb

HNR⁵R⁷ VIb

derivatisiert.

11. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen Ia, Ib, Ic und Id gemäß Anspruch 1, in denen R² 4,5-Dihydrooxazol-2-yl bedeutet, dadurch gekennzeichnet, daß man ein Carbonsäureamid der Formel Ia, Ib, Ic oder Id gemäß Anspruch 1, in der R² eine Gruppe CO₂H oder CO₂R⁵ und R⁵ C₁-C₄-Alkyl bedeuten, in an sich bekannter Weise mit einem Aminoalkohol XV

30



XV

cyclisiert.

12. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen Ia, Ib, Ic und Id gemäß Anspruch 1, in denen R² Formyl bedeutet, dadurch gekennzeichnet, daß man eine entsprechende Carbonsäure der Formel Ia, Ib, Ic oder Id (R²=CO₂H) in das Halogenid oder eine andere aktivierte Form der Carbonsäure überführt und dieses Derivat anschließend in an sich bekannter Weise reduziert.

13. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen Ia, Ib, Ic und Id gemäß Anspruch 1, in denen R¹ bzw. R¹ eine epoxidierte C₂-C₆-Alkenylgruppe bedeutet, dadurch gekennzeichnet, daß man ein Carbonsäureamid der Formel Ia, Ib, Ic oder Id gemäß Anspruch 1, wobei R¹ bzw. R¹ eine C₂-C₆-Alkenylgruppe bedeutet, in an sich bekannter Weise mit einem Oxidationsmittel epoxidiert.

14. Mittel, enthaltend inerte Trägerstoffe und eine herbizid wirksame Menge mindestens eines Carbonsäureamides der Formel Ia, Ib, Ic oder Id gemäß den Ansprüchen 1 bis 4.

15. Verfahren zur Bekämpfung unerwünschten Pflanzenwuchses, dadurch gekennzeichnet, daß man eine herbizid wirksame Menge eines Carbonsäureamids der Formel Id gemäß Anspruch 1 oder eines Carbonsäureamids der Formel Ia, Ib oder Ic, wobei Ia, Ib und Ic die Bedeutung von Ia, Ib bzw. Ic ohne die Ausnahmebestimmung hat, auf Pflanzen, deren Lebensraum oder auf Saatgut einwirken läßt.

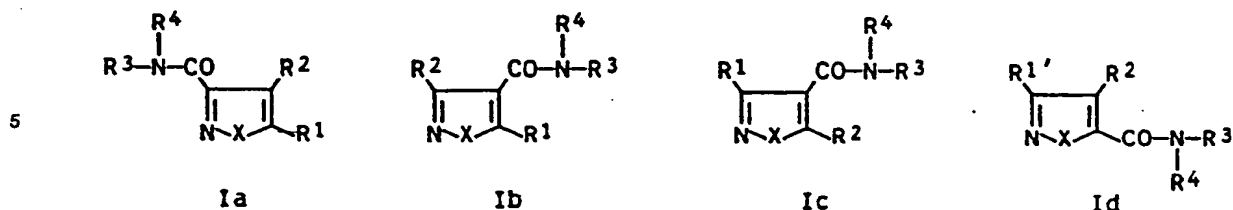
16. Iminoalkohole der allgemeinen Formel XVI.

HO-(C₁-C₆)-alkyl-CR¹⁰=N-R¹¹ XVI

in der die Substituenten R¹⁰ und R¹¹ die in Anspruch 1 genannte Bedeutung haben.

Patentansprüche für folgenden Vertragsstaat: ES

1. Mittel, enthaltend inerte Trägerstoffe und eine herbizid wirksame Menge mindestens eines Carbonsäureamides der Formel Ia, Ib, Ic oder Id



10 in denen die Variablen folgende Bedeutung haben:

X Sauerstoff oder Schwefel;

R¹ - Wasserstoff, Halogen, C₁-C₆-Alkyl, welches ein bis fünf Halogenatome und/oder einen Cyano- und/oder bis zu zwei der folgenden Reste tragen kann: C₁-C₄-Alkoxy, partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio oder partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₄-Alkylthio;

15 - eine C₁-C₄-Alkoxy- oder C₁-C₄-Alkylthiogruppe, eine partiell oder vollständig halogenierte C₁-C₄-Alkoxygruppe, eine partiell oder vollständig halogenierte C₁-C₄-Alkylthiogruppe;

- die Benzylgruppe, die ein- bis dreimal durch C₁-C₄-Alkyl, partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₄-Alkylthio, Halogen, Cyano oder Nitro substituiert sein kann;

20 - die Phenylgruppe, welche noch einen bis drei der folgenden Reste tragen kann: Cyano, Nitro, Halogen, C₁-C₆-Alkyl, partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Alkylthio und/oder partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₆-Alkylthio;

- die Phenoxy- oder die Phenylthiogruppe, wobei beide Gruppen ein- bis dreimal durch C₁-C₄-Alkyl, partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₄-Alkylthio, Halogen, Cyano oder Nitro substituiert sein können;

- ein 5- bis 6-gliedriger gesättigter oder aromatischer heterocyclischer Rest, enthaltend ein oder zwei Heteroatome, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff, der ein oder zwei der folgenden Substituenten tragen kann: Halogen, C₁-C₃-Alkyl, C₁-C₃-Alkoxy und C₁-C₃-Alkoxy-carbonyl;

30 - eine durch C₃-C₈-Cycloalkyl substituierte C₁-C₆-Alkylgruppe,

- eine C₂-C₆-Alkenylgruppe, deren Doppelbindung epoxidiert sein kann, oder eine C₂-C₆-Alkylgruppe, wobei beide Gruppen ein- bis dreimal durch Halogen, C₁-C₃-Alkoxy und/oder einmal durch Cyclopropyl oder Phenyl substituiert sein können, wobei der Phenylrest zusätzlich bis zu drei der folgenden Substituenten tragen kann: Halogen, Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, das unsubstituiert oder partiell oder vollständig

35 halogeniert sein kann, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Alkylthio, die beide unsubstituiert oder partiell oder vollständig halogeniert sein können,

- eine C₃-C₈-Cycloalkyl- oder eine C₃-C₆-Cycloalkenylgruppe, wobei beide Gruppen ein- bis dreimal durch C₁-C₄-Alkyl oder Halogen substituiert sein können;

R^{1'} - eine durch C₃-C₈-Cycloalkyl substituierte C₁-C₆-Alkylgruppe;

40 - eine C₂-C₆-Alkenylgruppe, deren Doppelbindung epoxidiert sein kann, oder eine C₂-C₆-Alkylgruppe, wobei beide Gruppen ein- bis dreimal durch Halogen, C₁-C₃-Alkoxy und/oder einmal durch Cyclopropyl oder Phenyl substituiert sein können, wobei der Phenylrest zusätzlich bis zu drei der folgenden Substituenten tragen kann: Halogen, Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, das unsubstituiert oder partiell oder vollständig

45 halogeniert sein kann, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Alkylthio, die beide unsubstituiert oder partiell oder vollständig halogeniert sein können;

- eine C₃-C₆-Cycloalkenylgruppe, die ein- bis dreimal durch Halogen oder C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann;

R² - eine Formylgruppe, eine 4,5-Dihydrooxazol-2-ylgruppe,

- ein Rest COYR⁵ oder CONR⁵R⁷, wobei die Variablen die folgende Bedeutung haben:

50 Y Sauerstoff oder Schwefel;

R⁵ - Wasserstoff;

- eine C₁-C₆-Alkylgruppe, welche ein bis fünf Halogenatome und/oder bis zu drei Hydroxy- und/oder C₁-C₄-Alkoxygruppen und/oder einen der folgenden Reste tragen kann:

- Cyano,

55 - C₁-C₄-Alkoxy-C₂-C₄-alkoxy,

- C₁-C₃-Alkylthio,

- C₁-C₃-Alkylamino, Di-(C₁-C₃)-alkylamino, C₃-C₆-Cycloalkylamino oder Di-(C₃-C₆)-cycloalkylamino,

- Trimethylsilyl,

- C₁-C₃-Alkylsulfinyl oder C₁-C₃-Alkylsulfonyl, Carboxyl, C₁-C₃-Alkoxy-carbonyl, C₁-C₃-Alkoxy-carbonyl-C₁-C₃-alkoxy oder C₁-C₃-Alkoxy-carbonyl-C₁-C₃-alkoxy-C₁-C₃-alkoxy-carbonyl,
- Di-(C₁-C₃)-alkylaminocarbonyl,
- Di-(C₁-C₃)-alkoxyphosphonyl,
- 5 - C₁-C₆-Alkaniminoxy oder C₅-C₆-Cycloalkaniminoxy,
- N-Phthalimido, N-Succinimido, Benzoyloxy, Benzoyl, wobei diese cyclischen Reste zusätzlich eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können: Halogen, C₁-C₃-Alkyl oder C₁-C₃-Alkoxy,
- einen 5- oder 6-gliedrigen gesättigten heterocyclischen Rest oder einen 5- oder 6-gliedrigen heteroaromatischen Rest mit jeweils bis zu 3 Heteroatomen, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff, wobei zwei Sauerstoff- und/oder Schwefelatome nicht direkt benachbart sein können und wobei
- 10 die Heterocyclen noch einen oder zwei der folgenden Substituenten tragen können: Halogen, C₁-C₃-Alkyl, C₁-C₃-Alkoxy oder C₁-C₃-Alkoxy-carbonyl;
- Phenyl, das noch bis zu drei der folgenden Substituenten tragen kann: Halogen, Nitro, Cyano, C₁-C₃-Alkyl, partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₃-Alkyl, C₁-C₃-Alkoxy oder partiell oder vollständig halogeniertes
- 15 C₁-C₃-Alkoxy;
- einen Rest -CR¹⁰ = N-R¹¹, wobei R¹⁰ und R¹¹ die folgende Bedeutung haben:
R¹⁰ Wasserstoff oder C₁-C₆-Alkyl und
R¹¹ C₁-C₆-Alkoxy, C₃-C₆-Alkenyloxy oder C₃-C₆-Alkinyloxy, die jeweils bis zu 3 Halogenatome und/oder einen Phenylrest mit gewünschtenfalls bis zu drei der folgenden Reste tragen können: Halogen, Nitro,
- 20 Cyano, C₁-C₃-Alkyl oder C₁-C₃-Alkoxy;
- Phenoxy, das noch bis zu drei der folgenden Substituenten tragen kann: Halogen, Nitro, Cyano, C₁-C₃-Alkyl oder C₁-C₃-Alkoxy;
- C₁-C₃-Alkylamino, Di-(C₁-C₆)-alkylamino oder Phenylamino, wobei der Aromat zusätzlich bis zu drei der folgenden Reste tragen kann: Halogen, Nitro, Cyano, C₁-C₃-Alkyl oder C₁-C₃-Alkoxy;
- 25 - C₃-C₈-Cycloalkyl;
- C₃-C₆-Alkenyl, C₅-C₆-Cycloalkenyl, C₃-C₆-Alkynyl, wobei diese Reste eine der folgenden Gruppen tragen können: Hydroxy, Halogen, C₁-C₄-Alkoxy oder Phenyl, wobei der Aromat seinerseits eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Halogen, Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Alkoxy;
- Phenyl, das eine bis-drei der folgenden Gruppen tragen kann: Halogen, Nitro, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl;
- einen fünf- oder sechsgliedrigen heterocyclischen Rest mit bis zu drei Heteroatomen, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff, wobei zwei Sauerstoff- und/oder Schwefelatome nicht direkt
- 35 benachbart sein können, und wobei die Heterocyclen noch einen oder zwei der folgenden Substituenten tragen können: Halogen, C₁-C₃-Alkoxy oder C₁-C₃-Alkoxy-carbonyl;
- einen Benzotriazolrest;
- N-Phthalimido, Tetrahydrophthalimido, Succinimido, Maleinimido;
- die 2,2-Dimethyl-1,3-dioxolan-4-ylmethyl- oder 1,3-Dioxolan-2-on-4-ylmethylgruppe;
- 40 - im Falle Y = O: ein Äquivalent eines Kations aus der Gruppe der Alkali- und Erdalkalimetalle, Mangan, Kupfer, Eisen, Ammonium und mit bis zu 4 C₁-C₃-Alkylgruppen substituiertes Ammonium;
- oder
- ein Rest -N = CR⁸R⁹, wobei
- R⁸, R⁹ Wasserstoff; C₁-C₄-Alkyl, das unsubstituiert oder partiell oder vollständig halogeniert sein kann und
- 45 einen C₁-C₃-Alkoxy- oder Phenylrest tragen kann, wobei der aromatische Rest seinerseits noch ein- bis dreimal durch Halogen, Nitro, Cyano, C₁-C₃-Alkyl, partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₃-Alkyl, C₁-C₃-Alkoxy oder partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₃-Alkoxy substituiert sein kann; C₃-C₆-Cycloalkyl; C₁-C₄-Alkoxy; Furanyl oder Phenyl, das zusätzlich bis zu 3 der folgenden Substituenten tragen kann: Halogen, Nitro, Cyano, C₁-C₃-Alkyl, partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₃-Alkyl, C₁-C₃-Alkoxy oder
- 50 partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₃-Alkoxy; oder R⁸ und R⁹ gemeinsam eine Methylenkette mit 4 bis 7 Gliedern bedeuten;
- einen Rest -W-Z, wobei W eine C₂-C₄-Alkylkette, eine Ethoxyethylenkette, eine But-2-enylen- oder eine But-2-inylenkette bedeutet und Z einen in ω -Stellung an W gebundenen Molekülteil, der den gleichen Molekülteil darstellt, der in α -Stellung von W mit W verknüpft ist, bedeutet;
- 55 R⁶ - Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl oder C₃-C₈-Cycloalkyl und
- R⁷ - Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, -C(OR¹²) = N-H oder -C(OR¹²) = N-(C₁-C₄)-alkyl, wobei R¹² C₁-C₄-Alkyl bedeutet oder
- R⁶, R⁷ gemeinsam eine Methylenkette mit 4 oder 5 Gliedern;

R³ - Wasserstoff;

- C₁-C₆-Alkyl, das einen bis drei der folgenden Substituenten tragen kann: Hydroxy, Halogen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio oder Di-(C₁-C₄)-alkylamino;

- C₃-C₈-Cycloalkyl, das ein- bis dreimal durch Halogen, C₁-C₄-Alkyl und partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann;

R⁴ - Wasserstoff, Hydroxyl, eine C₁-C₄-Alkoxygruppe;

- eine C₁-C₆-Alkylgruppe, die einen bis drei der folgenden Reste tragen kann: Halogen, Cyano, C₁-C₄-Alkoxy, partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₄-Alkylthio, Di-C₁-C₄-alkylamino, C₃-C₈-Cycloalkyl oder Phenyl, wobei der Phenylring seinerseits einen bis drei der folgenden Reste tragen kann: Halogen, Cyano, Nitro; C₁-C₄-Alkyl, partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio oder partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₄-Alkylthio;

- eine C₃-C₈-Cycloalkylgruppe, die einen bis drei der folgenden Reste tragen kann: Halogen, Nitro, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder partiell oder vollständig halogeniertes C₁-C₄-Alkoxy;

- eine C₃-C₆-Alkenyl- oder C₃-C₆-Alkynylgruppe, die jeweils ein- bis dreimal durch Halogen und/oder einmal durch Phenyl substituiert sein können, wobei der Phenylrest seinerseits eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, Halogen, Cyano oder Nitro;

- eine Di-(C₁-C₄)-alkylaminogruppe;

- ein 5- bis 6-gliedriger heterocyclischer gesättigter oder aromatischer Rest mit einem oder zwei Heteroatomen, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff, der ein- bis dreimal durch C₁-C₄-Alkyl oder Halogen substituiert sein kann;

- eine Phenylgruppe, die eine bis vier der folgenden Gruppen tragen kann: C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, Halogen, Nitro, Cyano, Formyl, C₁-C₄-Alkanoyl, C₁-C₄-Halogenalkanoyl oder C₁-C₄-Alkoxycarbonyl;

- eine Naphthylgruppe, die ein- bis dreimal durch C₁-C₄-Alkyl oder Halogen substituiert sein kann;

oder

R³, R⁴ gemeinsam eine Methylenkette mit 4 bis 7 Gliedern, welche durch Sauerstoff, Schwefel oder N-Methyl unterbrochen sein kann, oder den Rest -(CH₂)₃-CO-,

wobei im Falle der Verbindungen Ia bis Ic R³ und R⁴ nicht gleichzeitig Wasserstoff bedeuten, wenn

- R¹ Wasserstoff, Methyl oder Phenyl und R² CONH₂, CO₂H oder CO₂CH₃ bedeuten oder wenn

- X Sauerstoff, R¹ CH(OCH₂CH₃)₂ und R² CONH₂ bedeuten,

sowie deren umweltverträglichen Salze.

2. Mittel, enthaltend inerte Trägerstoffe und eine herbizid wirksame Menge mindestens eines Carbonsäureamides der Formel Ia, Ib, Ic oder Id nach Anspruch 1, wobei R³ Wasserstoff bedeutet.

3. Mittel, enthaltend inerte Trägerstoffe und eine herbizid wirksame Menge mindestens eines Carbonsäureamides der Formel Ia, Ib oder Ic nach Anspruch 1, wobei die Variablen die folgende Bedeutung haben:

R¹ Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl oder C₃-C₆-Cycloalkyl;

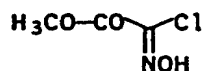
R² COYR⁵, wobei Y für Sauerstoff und R⁵ für Wasserstoff oder den Rest -N=CR⁸R⁹ stehen, wobei R⁸, R⁹ dabei unabhängig voneinander Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl und C₃-C₆-Cycloalkyl bedeuten oder zusammen eine C₄-C₇-Alkylenkette bilden;

R³ Wasserstoff und

R⁴ C₁-C₄-Alkyl oder C₃-C₆-Cycloalkyl.

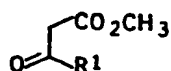
4. Mittel, enthaltend inerte Trägerstoffe und eine herbizid wirksame Menge mindestens eines Carbonsäureamides der Formel Ia gemäß den Ansprüchen 1 bis 3.

5. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen Ia und Ib gemäß Anspruch 1, in denen R² CO₂CH₃ und X Sauerstoff bedeutet, dadurch gekennzeichnet, daß man das Hydroxamsäurechlorid der Formel II



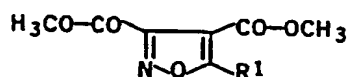
II

in an sich bekannter Weise in Gegenwart einer Base mit einem β -Ketoester der Formel III



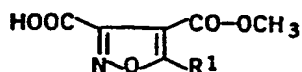
III

umsetzt, den so erhaltenen Dimethyldiester IV

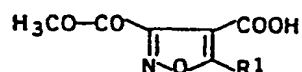


IV

anschließend zunächst mit einem Äquivalent einer wäßrigen Base zu den Monoestern Va und Vb

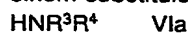


Va



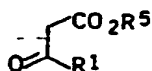
Vb

hydrolysiert und Va und Vb danach getrennt oder im Gemisch zuerst in an sich bekannter Weise in die Halogenide oder andere aktivierte Formen der Carbonsäuren überführt und diese Derivate anschließend mit einem substituierten Amin der Formel VIa



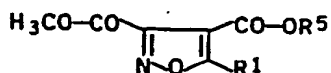
amidiert.

6. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen Ia gemäß Anspruch 1, in denen R^2 CO_2R^5 , X Sauerstoff und R^5 nicht Wasserstoff oder Methyl bedeuten, dadurch gekennzeichnet, daß man das Hydroxamsäurechlorid II in an sich bekannter Weise in Gegenwart einer Base mit einem β -Ketoester der Formel IIIa



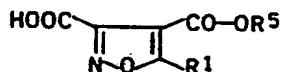
IIIa

umsetzt, den so erhaltenen Diester IVa



IVa

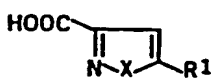
anschließend mit einem Verseifungsreagens zum Monoester Va'



Va'

hydrolysiert, Va' in an sich bekannter Weise in die Halogenide oder andere aktivierte Formen der Carbonsäuren überführt und diese Derivate anschließend mit einem substituierten Amin VIa amidiert.

7. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen Ia und Ic gemäß Anspruch 1, in denen R^1 nicht Wasserstoff und R^2 Carboxyl oder Formyl und R^3 Wasserstoff bedeuten, dadurch gekennzeichnet, daß man eine Carbonsäure Vc oder Vd



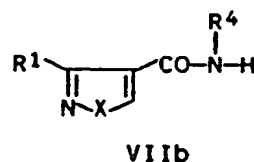
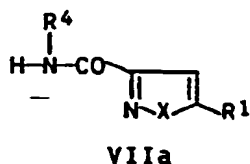
Vc



Vd

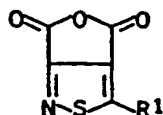
in an sich bekannter Weise in die Halogenide oder andere aktivierte Formen der Carbonsäuren überführt,

diese Derivate mit einem substituierten Amin VIa amidiert und das so erhaltene Amid VIIa bzw. VIIb



10 anschließend in an sich bekannter Weise in Gegenwart einer Base mit einem Carboxylierungs- oder einem Formylierungsreagens umsetzt.

8. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen Ia und Ib gemäß Anspruch 1, in denen R² eine Carboxylgruppe und X Schwefel bedeutet, dadurch gekennzeichnet, daß man ein Isothiazoldicarbonsäureanhydrid VIII



20 in an sich bekannter Weise mit einem Amin VIa zu den Isomeren Ia und Ib umsetzt und anschließend die Isomeren trennt.

9. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen Ia, Ib, Ic und Id gemäß Anspruch 1, in denen R² CO₂H bedeutet, dadurch gekennzeichnet, daß man einen entsprechenden Ester Ia, Ib, Ic oder Id, in dem R² CO₂R⁵ und R⁵ C₁-C₄-Alkyl bedeutet, in an sich bekannter Weise in Gegenwart einer wäßrigen Base hydrolysiert.

10. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen Ia, Ib, Ic und Id gemäß Anspruch 1, in denen R² eine Gruppe COYR⁵ oder CONR⁶R⁷ bedeutet, dadurch gekennzeichnet, daß man eine entsprechende Carbonsäure Ia, Ib, Ic bzw. Id (R² = CO₂H) zunächst in an sich bekannter Weise in die Halogenide oder andere aktivierte Derivate der Carbonsäuren überführt und diese Derivate anschließend in an sich bekannter Weise mit einer Verbindung IX

HYR⁵ IX

oder mit einem Amin VIb

HNR⁶R⁷ VIb

derivatisiert.

11. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen Ia, Ib, Ic und Id gemäß Anspruch 1, in denen R² 4,5-Dihydrooxazol-2-yl bedeutet, dadurch gekennzeichnet, daß man ein Carbonsäureamid der Formel Ia, Ib, Ic oder Id gemäß Anspruch 1, in der R² eine Gruppe CO₂H oder CO₂R⁵ und R⁵ C₁-C₄-Alkyl bedeuten, in an sich bekannter Weise mit einem Aminoalkohol XV



45 cyclisiert.

12. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen Ia, Ib, Ic und Id gemäß Anspruch 1, in denen R² Formyl bedeutet, dadurch gekennzeichnet, daß man eine entsprechende Carbonsäure der Formel Ia, Ib, Ic oder Id (R² = CO₂H) in das Halogenid oder eine andere aktivierte Form der Carbonsäure überführt und dieses Derivat anschließend in an sich bekannter Weise reduziert.

13. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen Ia, Ib, Ic und Id gemäß Anspruch 1, in denen R¹ bzw. R^{1'} eine epoxidierte C₂-C₆-Alkenylgruppe bedeutet, dadurch gekennzeichnet, daß man ein Carbonsäureamid der Formel Ia, Ib, Ic oder Id gemäß Anspruch 1, wobei R¹ bzw. R^{1'} eine C₂-C₆-Alkenylgruppe bedeutet, in an sich bekannter Weise mit einem Oxidationsmittel epoxidiert.

14. Verfahren zur Bekämpfung unerwünschten Pflanzenwuchses, dadurch gekennzeichnet, daß man eine herbizid wirksame Menge eines Carbonsäureamids der Formel Id gemäß Anspruch 1 oder eines Carbonsäureamids der Formel Ia, Ib oder Ic, wobei Ia, Ib und Ic die Bedeutung von Ia, Ib bzw. Ic ohne die Ausnahmebestimmung hat, auf Pflanzen, deren Lebensraum oder auf Saatgut einwirken läßt.